



República Federativa do Brasil
Ministério do Desenvolvimento, Indústria
e do Comércio Exterior
Instituto Nacional da Propriedade Industrial.

(21) **PI 0712154-7 A2**

(22) Data de Depósito: 06/06/2007
(43) Data da Publicação: 10/01/2012
(RPI 2140)



(51) *Int.Cl.:*
A61K 8/49
A61Q 15/00
C07D 211/46

(54) **Título:** COMPOSTOS DE PIPERIDÍNIO E COMPOSIÇÕES COSMÉTICAS CONTENDO-OS

(30) **Prioridade Unionista:** 09/06/2006 US 11/449,720

(73) **Titular(es):** Beiersdorf Ag

(72) **Inventor(es):** Annette Martin, Lara Terstegen, Melanie Sulzberger, Michael Wörrmann

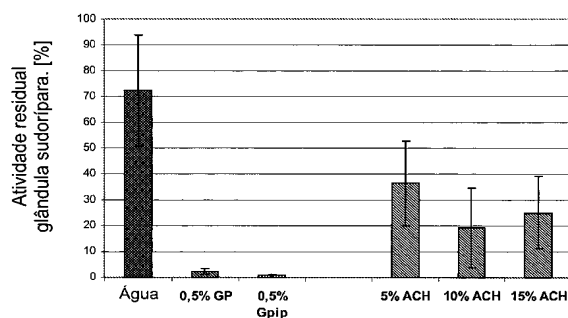
(74) **Procurador(es):** Dannemann, Siemsen, Bigler & Ipanema Moreira

(86) **Pedido Internacional:** PCT EP2007055555 de 06/06/2007

(87) **Publicação Internacional:** WO 2007/141289de 13/12/2007

(57) **Resumo:** COMPOSTOS DE PIPERIDÍNIO E COMPOSIÇÕES COSMÉTICAS CONTENDO-OS. A presente invenção refere-se a composições cosméticas ou dermatológicas que compreendem pelo menos um sal de piperidínio, preferivelmente um sal de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]1, 1 -dimetil-piperidínio, e o seu uso, particularmente como antiperspirantes.

Estudo de impressão (in vivo)



Relatório Descritivo da Patente de Invenção para "**COMPOSTOS DE PIPERIDÍNIO E COMPOSIÇÕES COSMÉTICAS CONTENDO-OS**".

FUNDAMENTOS DA INVENÇÃO

5 1. Campo da Invenção

A presente invenção refere-se aos compostos de piperidínio e em particular seu uso em composições para aplicação tópica, em particular antiperspirantes. Os compostos preferidos de piperidínio incluem sais de 1,1-dimetil-4-[2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil]óxi-piperidínio e sais de 1,1-
10 dimetil-4-[3-metil-2-fenilvaleril]óxi-piperidínio, em particular brometo de 1,1-dimetil-4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-piperidínio. Seu uso em composições terapeuticamente ativas ou cosméticas é vantajoso.

2. Discussão das Informações Antecedentes

Vários compostos químicos para o tratamento de doenças da
15 vesícula são conhecidos da patente norte-americana nº 6.482.837, cuja descrição inteira é aqui incorporada por referência. Os compostos de N-metil-4-piperidínio substituídos, *inter alia*, são nesse particular descritos, uma pluralidade de resíduos moleculares e combinações e variações destes resíduos sendo descritos. Os compostos descritos na Patente norte-americana nº
20 6.482.837 servem a todos os propósitos médicos e em particular o tratamento de doenças da vesícula.

Além disso, da literatura são conhecidos 4- [ciclopentilidroxifenilacetil]óxi]-1,1-dimetil-piperidínio com CAS número 807285-21-8 e iodeto de 4-hidróxi-1,1-dimetilpiperidínio, α -ciclopentil mandelato com CAS número
25 113569-69-0 e brometo de 1,1-dimetil-4-[3-metil-2-fenilvaleril]óxi-piperidínio com CAS número 100337-30-2. No entanto, outras informações com respeito a estes compostos, em particular sobre as suas possíveis aplicações, não são encontradas na literatura.

Em seres humanos duas diferentes glândulas sudoríparas são
30 responsáveis pelo desenvolvimento da perspiração e odor da perspiração, que são mais ou menos pronunciados, dependendo da área do corpo. As glândulas sudoríparas ecrinas eliminam principalmente sal e água e geral-

mente não contribuem para formação do odor. As glândulas sudoríparas apócrinas são responsáveis pelo odor, que eliminam ácidos graxos, colesterol e outros compostos. Estas substâncias são decompostas pelas bactérias na pele, os produtos de decomposição química que produzem o odor típico da perspiração.

De modo a suprimir o odor da perspiração durante um período mais longo, o uso de preparações cosméticas é essencial. Os desodorantes cosméticos convencionais se baseiam em diferentes mecanismos de ação que também podem ser combinados: por um lado agentes desodorizantes são usados os quais suprimem o crescimento das bactérias que causam o odor da perspiração. Estes agentes antimicrobianos (bacteriostáticos) incluem, por exemplo, triclosan, clorexidina e compostos de ocorrência natural tais como farnesol e fenoxietanol.

Por outro lado, os antiperspirantes são usados os quais impedem a secreção de suor mediante o bloqueio dos canais da glândula sudorípara. Na grande maioria dos antiperspirantes, a formação da perspiração é reduzida pelo uso dos assim chamados adstringentes – principalmente sais de alumínio tais como hidroxicloreto de alumínio (cloridrato de alumínio) ou sais de alumínio/zircônio.

Da mesma forma a combinação de adstringentes com substâncias antimicrobialmente ativas em uma e na mesma composição é costumeiro. Além disso, fragrâncias são usadas para mascarar o odor da perspiração.

Entretanto, o cloridrato de alumínio convencionalmente usado como um antiperspirante possui várias desvantagens devido ao caráter ácido e o mecanismo ativo, que variam do manchamento têxtil conhecido por amarelamento às instabilidades de perfume em uma seleção limitada de fórmulas. É uma desvantagem particular para o usuário em que os resíduos possam manchar a roupa em uma maneira desagradável e o valor de pH baixo (muito ácido) da preparação cosmética negativamente impacta o equilíbrio biológico da pele.

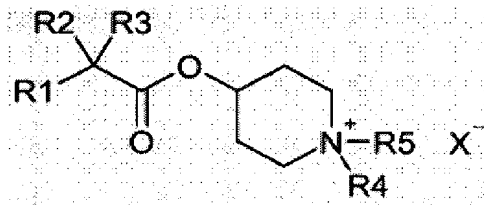
Seria desejável produzir compostos que sejam toxicologicamente inofensivos, possam ser facilmente incorporados sem complicações nas

preparações terapeuticamente ativas ou cosméticas, sejam fáceis de sintetizar e além do mais terem uma ou mais propriedades vantajosas adicionais. Deve ser particularmente vantajoso produzir substâncias para uso nas composições terapêuticas ou cosméticas que possuam o efeito de reduzir ou inibir a perspiração.

Também deve ser desejável produzir cosméticos e em particular produtos antiperspirantes que não apresentem as desvantagens da técnica anterior e preferivelmente tornem supérflua a necessidade do uso de agentes antiperspirantes com base em compostos de alumínio ou pelo menos ajudem a reduzi-los.

SUMÁRIO DA INVENÇÃO

A presente invenção fornece composições cosméticas ou dermatológicas que compreendem pelo menos um sal de piperidínio de fórmula (I):



(I)

e um veículo cosmética ou dermatologicamente aceitável.

Na fórmula (I), os radicais R_1 até R_5 e X^- possuem os seguintes significados:

R_4 e R_5 independentemente representam H ou alquila $C_1 - C_6$;

R_1 e R_3 independentemente representam cicloalquila $C_3 - C_8$ opcionalmente substituída, fenila opcionalmente substituída ou alquila $C_1 - C_6$ opcionalmente substituída saturada ou insaturada;

R_2 representa H, OH e OR, com R representando ou alquila $C_1 - C_7$ (linear, ramificada, cíclica, saturada ou insaturada tal como, por exemplo, metila, etila, n-propila, isopropila, alila, propargila, n-butila, ciclopentila e ciclo-hexila); e

X^- representa um ânion cosmética ou dermatologicamente aceitável.

Os compostos de fórmula (I) podem, por exemplo, estar presentes como isômeros individuais (por exemplo, enantiômeros), como quaisquer misturas de isômeros e como racematos.

Os significados de preferidos de R_1 até R_5 e X são como se segue:

R_4 e R_5 alquila $C_1 - C_4$, em particular alquila $C_1 - C_3$, preferivelmente metila e etila e particularmente preferível metila; R_4 e R_5 são preferivelmente idênticos;

R_1 cicloalquila $C_3 - C_8$ opcionalmente substituída ou fenila opcionalmente substituída, em particular fenila (preferivelmente não-substituída);

R_3 alquila $C_3 - C_8$ opcionalmente substituída, cicloalquila $C_3 - C_8$ ou fenila opcionalmente substituída; preferivelmente alquila $C_3 - C_6$, cicloalquila ou fenila $C_3 - C_6$, particularmente preferível (preferivelmente não-substituída) ciclopentila, ciclo-hexila, isopropila, 2-butila, 2-pentila, 3-pentila, 2-hexila e 3-hexila;

R_2 H, OH ou OR, com R representando alquila $C_1 - C_3$, em particular H ou OH;

X halogêneo (flúor, cloro, bromo e iodo), sulfato, carbonato, ascorbato ou fosfato, em particular halogêneo, preferivelmente Cl, Br e I, ainda mais preferivelmente bromo.

Exemplos específicos não-limitativos dos vários grupos de (ciclo)alquila R_1 e R_3 até R_5 na forma não-substituída são como se segue:

R_4 e R_5 metila, etila, propila, isopropila, n-butila, 2-butila, sec-butila, isobutila, pentila e hexila;

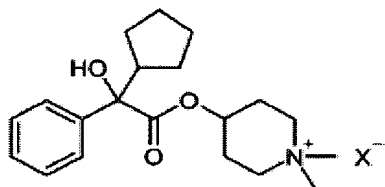
R_1 ciclopropila, ciclobutila, ciclopentila, ciclo-hexila, ciclo-heptila e ciclo-octila;

R_3 ciclopropila, ciclobutila, ciclopentila, ciclo-hexila, ciclo-heptila, ciclo-octila, isopropila, 2-butila, 2-pentila, 3-pentila, 2-hexila e 3-hexila.

Os substituintes exemplares incluem halogêneo, em particular F, Cl e Br, hidroxila (OH), alcóxi $C_1 - C_4$ (por exemplo, metóxi e etóxi), amino, mono (alquila $C_1 - C_4$)amino, di(alquila $C_1 - C_4$)amino, opcionalmente alquila $C_1 - C_5$ opcionalmente substituída (por exemplo, metila, etila, propila, iso-

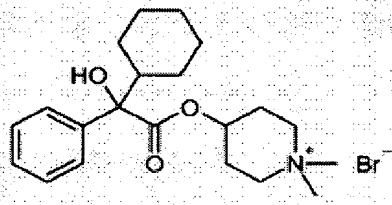
propila, n-butila, 2-butila, isobutila e terc-butila), COOH e SO₃H. Os grupos de cicloalquila e fenila podem ter um, dois, três ou ainda mais substituintes. Preferivelmente estes grupos são não-substituídos.

Em um aspecto da composição, o pelo menos um composto de fórmula (I) pode compreender um sal de 4[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio de fórmula



em que X⁻ é definido como acima.

Em um outro aspecto da composição, o pelo menos um composto de fórmula (I) pode compreender um sal de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio de fórmula

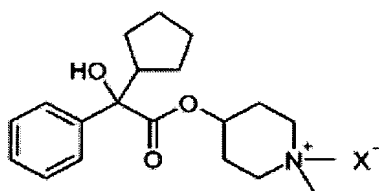


em que X⁻ é definido como acima.

Em mais um outro aspecto, a composição de acordo com a presente invenção pode conter pelo menos um sal de fórmula (I) em uma concentração de cerca de 0,001 % a cerca de 15 % em peso, com base no peso total da composição. Por exemplo, a composição pode conter pelo menos um sal de fórmula (I) em uma concentração de cerca de 0,05 % a cerca de 10 % em peso, ou em uma concentração de cerca de 0,1 % a cerca de 5 % em peso.

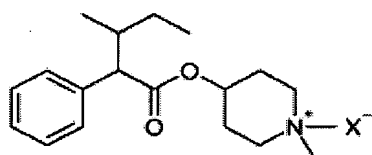
Em um outro aspecto, a composição da presente invenção pode compreender:

(a) um ou mais sais de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio de fórmula



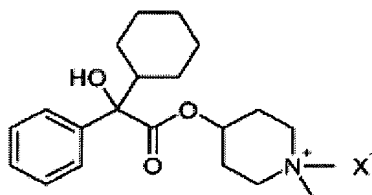
e/ou

(b) um ou mais sais de 4-[[2-(2-butyl)-fenilacetil]óxi]-1,1-dimetil-piperidínio (nome IUPAC: sais de 1,1-dimetil-4-[(3-metil-2-fenil-pentanoil)óxi]-piperidínio) de fórmula



5 e/ou

(c) um ou mais sais de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio de fórmula



em que X⁻ é como definido acima e preferivelmente representa brometo.

Em um outro aspecto, a composição de acordo com a presente
 10 invenção pode estar presente em uma forma que é adequada para a aplicação tópica. Por exemplo, a composição pode estar presente na forma de um creme, uma loção, um gel, um unguento, uma tintura, um óleo de pele, uma solução leitosa, um bálsamo, uma bandagem impregnada com a composição, um tecido impregnado com a composição, um têxtil impregnado com a
 15 composição, um tampão impregnado com a composição, um spray, um aerossol, um sólido "role-on", um bastão, um sólido flexível, um pó ou um spray em pó.

Em um outro aspecto, a composição de acordo com a presente
 invenção pode estar presente em uma forma que seja adequada para uso
 20 como um antiperspirante.

Em um outro aspecto, a composição pode ainda compreender pelo menos uma substância desodorizante.

Em um outro aspecto, a composição de acordo com a presente invenção pode ainda compreender um composto de alumínio ativo antiperspirante. Por exemplo, o pelo menos um composto de alumínio ativo antiperspirante pode estar presente em uma concentração de cerca de 0,1 % a cerca de 30 % em peso, por exemplo, em uma concentração de cerca de 1 % a cerca de 15 % em peso, com base no peso total da composição. O composto de alumínio ativo antiperspirante pode compreender, por exemplo, cloridrato de alumínio, cloreto de alumínio e/ou um composto de alumínio zircônio.

Em um outro aspecto, a composição pode ser essencialmente livre de substâncias ativas antiperspirantes que são diferentes de um sal de fórmula (I). Em particular, a composição pode ser substancialmente livre de compostos de alumínio.

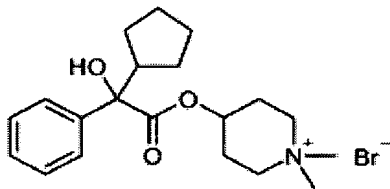
Em um outro aspecto, a composição de acordo com a presente invenção pode estar presente na forma de um líquido ou sabão em barra, um aerossol, um desodorante de bastão, um creme, uma loção, uma tintura desodorizante, um agente de limpeza íntima desodorizante, um xampu desodorizante, um banho de chuveiro desodorizante ou preparação de banho, um pó desodorizante ou um spray em pó desodorizante e/ou a composição pode estar presente em combinação com um recipiente de aerossol, um frasco de compressão, um dispositivo de bomba ou um dispositivo role-on.

A presente invenção também fornece um método para a redução ou a inibição da formação de perspiração. O método compreende a aplicação de uma quantidade eficaz antiperspirante de uma composição de acordo com a presente invenção como apresentada acima (incluindo os seus diferentes aspectos) sobre a pele (humana).

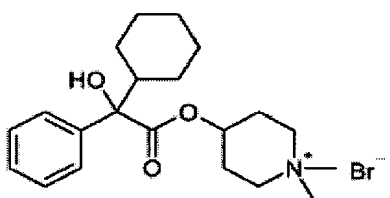
Em um aspecto do método, a aplicação da composição pode ser realizada com o uso de ultrassom, um mecanismo de iontoforese, microcanais e/ou microagulhas.

A presente invenção também fornece novos compostos da fór-

mula acima (I), em particular brometo de 4-[2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio de fórmula



e brometo de 4-[2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio de fórmula

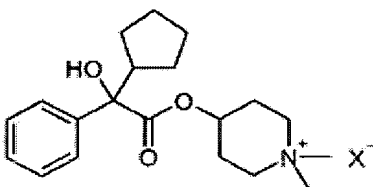


- 5 Estes compostos e em particular o composto de ciclopentila, são compostos preferidos para uso nas composições e métodos da presente invenção.

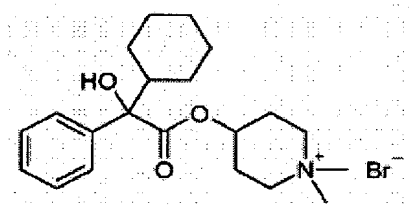
DESCRIÇÃO DETALHADA DA INVENÇÃO

- Os particulares aqui mostrados são por meio de exemplo e para
 10 propósitos de argumentação ilustrativa das formas de realização da presente invenção unicamente e são apresentados no interesse de fornecer aquilo que é julgado ser a descrição mais útil e mais facilmente entendida dos princípios e aspectos conceituais da presente invenção. A este respeito, nenhuma tentativa é feita para mostrar os detalhes da presente invenção em maior
 15 quantidade de detalhes do que é necessária para a compreensão fundamental da presente invenção, a descrição se torna evidente para aqueles versados na técnica para como as várias formas da presente invenção possam ser personificadas na prática.

- Como apresentado acima, particularmente vantajoso para os
 20 propósitos da presente invenção são os compostos de fórmula



e da fórmula



Estes compostos de fenilacetóxi piperidínio particularmente preferidos, no que segue referidos como sais de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio e sais de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio, são fáceis de incorporar nas composições terapeuticamente ativas ou cosméticas.

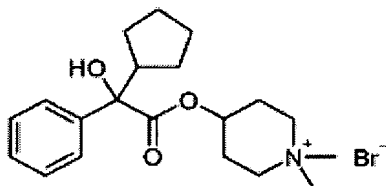
Um outro grupo preferido de compostos compreende compostos em que X^- na fórmula (I) é um ânion cosmeticamente aceitável, preferivelmente selecionado de bromo, iodo, cloro, flúor, sulfato, carbonato, ascorbato, acetato, fosfato e misturas dos mesmos (o brometo sendo particularmente preferido), R_4 e R_5 são ambos radicais de metila, R_3 é um radical de ciclopentila, ciclo-hexila ou 2-butila, R_1 é um radical de fenila não-substituído e R_2 representa hidrogênio ou hidróxi.

Além disso, a presente invenção compreende o uso de um ou mais compostos de piperidínio, preferivelmente selecionados de sais de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio, sais de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio e sais de 4-[(2-butil)-fenilacetil]óxi]-1,1-dimetil-piperidínio, em composições terapeuticamente ativas ou cosméticas.

Além do mais, a presente invenção fornece composições que compreendem um ou mais compostos de piperidínio de fórmula (I), preferivelmente sais de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio, sais de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio e/ou sais de 4-[(2-butil)-fenilacetil]óxi]-1,1-dimetil-piperidínio, e em particular preparações que podem ser aplicadas topicamente, preferivelmente preparações cosméticas, que compreendem um ou mais destes compostos.

Os compostos preferidos de fórmula (I) incluem brometo de 4-

[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio de fórmula

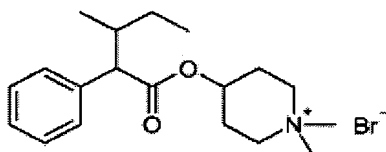


Além do brometo, outros sais, tais como, por exemplo, iodeto, cloreto, fluoreto, sulfato, carbonato, ascorbato ou também outros sais (por exemplo, determinados pelo processo de preparação) assim como opcio-

5 nalmente suas misturas, também podem ser usados. Como ânions, em particular estes são selecionados os quais podem ser usados em cosméticos. Apenas em consideração a simplicidade no que segue, referência é feita principalmente ao composto de brometo preferível acima como representan-

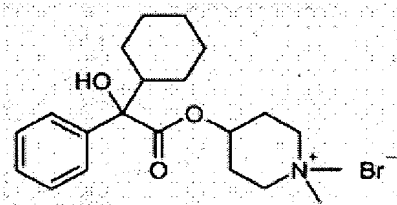
10 te dos compostos da presente invenção.

Do mesmo modo, particularmente vantajoso é o brometo de 4-[[2-(2-butil)-2-fenilacetil)óxi]]-1,1-dimetil-piperidínio de fórmula:



Neste caso, R_4 e R_5 na fórmula (I) são radicais de metila, R_3 é um radical de 2-butila, R_1 é um radical de fenila não-substituído e R_2 representa hidrogênio. X^- representa brometo.

Da mesma maneira particularmente vantajoso é o brometo de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio de fórmula:



Neste caso, R_4 e R_5 na fórmula (I) são radicais de metila, R_3 é um radical de ciclo-hexila, R_1 é um radical de fenila não-substituído e R_2 representa hidróxi. X^- representa brometo.

20 Surpreendentemente, os compostos de piperidínio usados de

acordo com a presente invenção, em particular os sais de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio, os sais de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio e os sais de 4-[[2-(2-butil)-fenilacetil]óxi]-1,1-dimetil-piperidínio e especialmente, os brometos, apresentam uma eficácia muito boa na inibição da perspiração. Estes compostos, em particular os sais de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio e em particular o brometo, desta maneira representam uma alternativa para os agentes conhecidos para a inibição ou redução da perspiração.

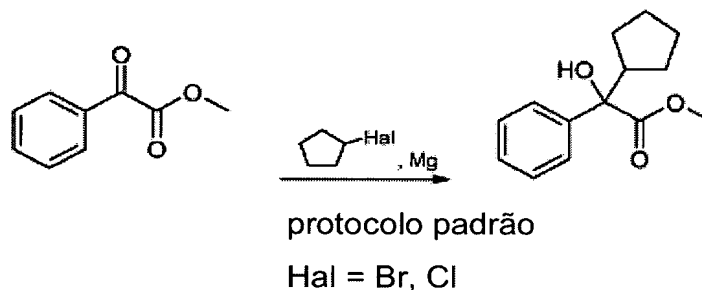
Os compostos de piperidínio usados de acordo com a presente invenção, em particular, os sais de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio, os sais de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio e os sais de 4-[[2-(2-butil)-fenilacetil]óxi]-1,1-dimetil-piperidínio, podem assim preferivelmente ser usados para a inibição ou pelo menos significativamente para a redução da perspiração. Eles são fáceis de produzir e podem facilmente ser incorporados em uma pluralidade de formulações terapeuticamente ativas ou cosméticas.

Os compostos de piperidínio usados de acordo com a presente invenção podem ser produzidos sinteticamente em algumas etapas a partir dos materiais de partida comercialmente disponíveis. Um possível e preferível caminho sintético, apresentado por meio de exemplo para os sais de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio, se inicia a partir do metil (2-ciclopentil mandelato) e 4-hidróxi-N-metilpiperidina que são reagidos em uma reação de esterificação. A última etapa da síntese é a conversão no composto de piperidínio correspondente, isto é, a quaternização do átomo de nitrogênio com os reagentes comumente usados para este propósito, tais como, por exemplo, metilbrometo. O metil (2-ciclopentil mandelato) pode, por exemplo, além de muitas outras variantes concebíveis, ser preparado por uma reação de acoplamento (por exemplo, uma reação de Grignard) de, por exemplo, metilfenilglioxilato (CAS N°. 15205-55-0) com haletos de ciclopentila. Através dos compostos de partida adequados e condições de reação adequadas, o composto também pode ser preparado na forma enan-

tiomericamente pura ou enantiomericamente enriquecida, respectivamente.

O seguinte esquema de reação ilustra a síntese apresentada acima:

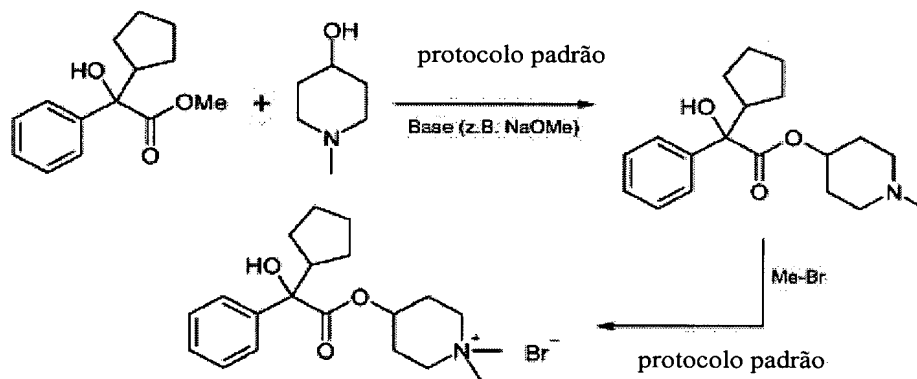
Reação de Grignard



5

Resultados particularmente vantajosos são obtidos na reação de Grignard se ZnBr_2 for usado como aditivo.

Reação de Transesterificação e Quaternização:



A presente invenção abrange não apenas os compostos de piperidínio acima em general e em particular, os sais de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio e os sais de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio, mas também abrange os isômeros individuais e quaisquer misturas desejadas destes, mesmo se, em consideração a simplicidade, estes composto forem aqui questionados sem qualquer informação estereoquímica. O uso de misturas racêmicas é particularmente preferível. Se durante uma reação uma mistura 1 : 1 de enantiômeros for formada, esta é chamada de uma mistura de racemato ou racêmica.

Surpreendentemente, os compostos de piperidínio usados de acordo com a presente invenção, em particular os sais de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio e os sais de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio, e em particular os brometos, são

toxicologicamente inofensivos, os quais não podem necessariamente ser esperados unicamente com base nas suas unidades de estrutura química.

A aplicabilidade, em particular, dos sais de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio e sais de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio em todas as formas de produto ou aplicação concebíveis que permitem qualquer tipo de contato com seres humanos, é particularmente surpreendente.

Os sais de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio e os sais de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio e em particular, os brometos, apresentam uma efetividade na redução ou mesmo inibição da perspiração.

Além do mais, é surpreendente e vantajoso que os sais de fenilacetóxi piperidínio e, em particular, os sais de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio, especialmente o brometo, sejam facilmente solúveis em água. A incorporação nas composições com base em água conhecidas é desta maneira possível e preferível.

Além das formas de aplicação médicas como um agente terapêutico, isto é, como uma preparação farmacêutica, o uso dos presentes compostos de piperidínio em cosméticos é possível e preferível.

Em particular, o brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio pode, portanto, ser usado como um agente terapêutico, em uma preparação farmacêutica e aqui, em particular, para a redução ou inibição da formação de perspiração.

No presente relatório descritivo e nas reivindicações anexas os termos "composição" e "agente" incluem todas as formas de aplicação, preparações, meios ou substâncias que podem ser usadas em, sobre, por e/ou com objetos, em métodos e/ou para aplicação sobre a pele humana.

Estas formas de aplicação são aqui resumidas como formas de aplicação tópicas e compreendem, em particular, todas as formas de administração e aplicação para a aplicação externa na pele humana. A aplicação tópica é, portanto, preferida e compreende o uso ou aplicação externa tópica, tal como a aplicação como um creme, uma loção, um gel, um unguento,

uma tintura, um óleo de pele, uma loção leitosa, um bálsamo, por meio de um emplastro, um tecido, um têxtil, um tampão, como um spray, como um atomizador, um aerossol, um role-on, um bastão, um sólido, um pó, um spray em pó e outras formas conhecidas de aplicação tópica, tais como, por exemplo, inserção na pele por um mecanismo de iontoforese, de ultrassom, de microcanais ou de microagulhas e outros mais. Com estes métodos, um reforço distinto de penetração é obtido, que pode levar a um efeito intensificado.

Os compostos de piperidínio de acordo com a presente invenção, preferivelmente nas formas de aplicação apresentadas acima, e como substâncias facilmente solúveis em água, podem ser misturados em quantidades relativamente grandes e com os métodos de produção cosmética usuais nas preparações cosméticas e/ou dermatológicas.

Em particular os sais de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio e os sais de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio, especialmente os brometos, podem, portanto, preferivelmente ser usados como cosméticos ou como constituintes de composições cosméticas.

A concentração dos compostos de piperidínio, em particular os sais de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio e os sais de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio, em uma composição, individualmente ou como misturas, geralmente é pelo menos cerca de 0,001 % em peso, preferivelmente pelo menos cerca de 0,05 % em peso, particularmente preferível pelo menos cerca de 0,1 % em peso, mas geralmente não mais elevado do que cerca de 15 % em peso, preferivelmente não mais elevado do que cerca de 10 % em peso, particularmente preferível não mais elevado do que cerca de 5 % em peso, com base no peso total da composição.

Particularmente os sais de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio e os sais de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio, preferivelmente os brometos, podem ser usados individualmente ou em misturas, particularmente na forma

de um agente tópico par a redução eficaz da perspiração.

É, além disso, preferível de acordo com a presente invenção com relação às composições tópicas, não incluir produtos farmacêuticos ou agentes com um efeito terapêutico. Consequentemente, as composições da presente invenção preferivelmente não contêm agentes terapêuticos. No entanto, se os agentes terapêuticos forem incluídos nas composições, eles são preferivelmente selecionados daqueles que são convencionalmente administrados mediante a aplicação tópica na pele, tais como, por exemplo, antimicóticos.

O uso dos compostos de piperidínio usados de acordo com a presente invenção, em particular dos sais de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio e os sais de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio, também é preferível para ferimentos e tratamento da pele, como constituintes de composições deterativas e composições de limpeza, em cosméticos (preferivelmente decorativos), e em particular, em composições desodorantes/antiperspirantes.

Geralmente, os cosméticos são cremes, unguentos e outras composições que são aplicadas na pele. Eles servem para acentuar as partes individuais do corpo, principalmente na face (batom, sombra para os olhos) ou para cobri-las, por exemplo, manchas, acne etc. Em general, os cosméticos são usados para o embelezamento, mas não para propósitos medicinais.

Devido ao seu efeito anti-hidrótico, em particular os sais de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio e os sais de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio, preferivelmente os brometos, podem ser usados vantajosamente em desodorantes e antiperspirantes.

Surpreendentemente, a presente invenção fornece um remédio para as desvantagens descritas dos agentes antiperspirantes conhecidos, em particular compostos de alumínio, visto que, devido ao efeito anti-hidrótico, por exemplo, dos sais de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio e dos sais de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-

1,1-dimetil-piperidínio, a quantidade de agentes antiperspirantes usados, tais como ACH, pode ser reduzida ou completamente eliminada.

Além do mais, particularmente os sais de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio apresentam uma boa tolerância e preferivelmente significativamente não inibem a eficácia dos agentes antiperspirantes.

Uma outra possível vantagem associada com a presente invenção é que, em particular, os sais de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio e os sais de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio, preferivelmente os brometos, podem ser usados nas composições desodorantes/antiperspirantes como substâncias antimicrobianas para a redução do odor tanto em combinação com os agentes desodorantes/antiperspirantes padrão tais como, por exemplo, cloridrato de alumínio ou outros sais de alumínio quanto da mesma forma completamente sem tais agentes padrão.

É, portanto, possível fornecer composições desodorantes/antiperspirantes que preferivelmente compreendem de cerca de 0,01 a cerca de 25 % em peso de agentes antiperspirantes contendo alumínio, em particular cloridratos de alumínio, em combinação com os sais de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio e outros sais de piperidínio da presente invenção.

Além disso, existe a propriedade extremamente vantajosa de boa solubilidade em água dos compostos usados de acordo com a presente invenção.

Devido às suas propriedades vantajosas, as preparações cosméticas da presente invenção podem ser empregadas, por exemplo, na forma de aerossóis, assim as preparações que podem ser pulverizadas a partir dos recipientes de aerossol, frascos de compressão ou por um dispositivo de bomba, ou na forma de composições líquidas que podem ser aplicadas por meio de dispositivos deslizantes ou com uma escova, como bastões desodorantes e na forma de emulsões de A/O ou de O/A, por exemplo, cremes ou loções, que podem ser aplicadas de frascos ou recipientes normais, ou na

forma de líquido ou sabões em barra. Além disso, os desodorantes cosméticos podem vantajosamente estar presentes na forma de tinturas desodorizantes, agentes de limpeza de higiene feminina desodorizantes, xampus desodorizantes, banho de chuveiro desodorizante ou preparações de banho, pos desodorizantes ou sprays em pó desodorizantes.

Além destas preparações e formas de aplicação, aqueles versados na técnica também estão cientes das tecnologias modernas para a formulação dos ingredientes ativos para a otimização dos parâmetros estabilidade, solubilidade, controle de liberação e biodisponibilidade. As tecnologias de formulação modernas incluem, por exemplo, microencapsulação e nanoencapsulação (princípio de matriz), sistemas de membrana (por exemplo, lipossomas) assim como ciclodextrinas. Alguns destes métodos são descritos, por exemplo, no livro didático *Pharmazeutische Technologie: Moderne Arzneiformen*, 2. ed., Wiss. Verl.-Ges. 1998 by Rainer H. Muller and Gesine H. Hildebrand, cuja descrição é aqui incorporada por referência.

Exemplos não-limitativos de materiais para estas tecnologias de formulação incluem ceras, lipídeos, fosfolipídeos, polímeros naturais e sintéticos e também ciclodextrinas. As dimensões destes sistemas são geralmente da ordem de cerca de 0,01 μm a cerca de 50 μm .

Da mesma maneira, preferível é o uso dos compostos de piperidínio de acordo com a presente invenção, em particular os sais de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio e os sais de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio, em curativos de ferimentos e tratamento da pele e como constituintes de preparações deterativas e composições de limpeza.

Naturalmente, é conhecido daqueles versados na técnica que as preparações cosméticas são geralmente inconcebíveis sem os agentes e aditivos gerais auxiliares. As preparações cosméticas de acordo com a invenção podem conseqüentemente ainda conter agentes auxiliares cosméticos como são convencionalmente usados em tais preparações; por exemplo, reforçadores, conservantes, estabilizantes, cargas, perfumes, pigmentos com/sem efeito colorante, espessantes, substâncias tensoativas, emolientes,

cremes hidratantes e/ou umectantes, substâncias anti-inflamatórias, agentes ativos adicionais, tais como vitaminas ou proteínas, agentes de proteção da luz, repelentes de inseto, bactericidas, virucidas, água, sais, substâncias antimicrobianas, proteolíticas ou queratolíticas, medicamentos ou outros constituintes costumeiros de uma formulação cosmética ou dermatológica, tais como álcoois, políeis, polímeros, estabilizantes de espuma, solventes orgânicos e também eletrólitos.

As preparações cosméticas e/ou dermatológicas de acordo com a presente invenção também podem estar presentes como géis que além de uma quantidade eficaz dos compostos usados de acordo com a presente invenção e solventes convencionalmente usados com estes, geralmente e de modo preferível água, também contêm espessantes orgânicos e/ou inorgânicos. Além disso, estes espessantes são um constituinte de emulsões cosméticas.

Como emulsificantes para a produção das preparações de acordo com a presente invenção, que podem vantajosamente ser aplicadas nas áreas desejadas da pele como preparações líquidas ou sólidas, e que podem ser usadas nas preparações em pequenas quantidades, por exemplo, de cerca de 1 % a cerca de 6 % em peso, os tipos não-iônicos têm comprovado de serem adequados, tais como éteres de álcool graxo de polioxietileno, por exemplo, éter polietileno glicol de álcool cetostearílico tendo de 12 ou 20 unidades de óxido de etileno por molécula, álcool cetoestearílico e ésteres de sorbitano e compostos de éster sorbitano-óxido de etileno (por exemplo, monoestearato de sorbitano e monoestearato de polioxietileno sorbitano), e éteres de poliglicol graxo de peso molecular mais elevado de cadeia longa. Além disso, no entanto, um número grande de outros emulsificantes ou misturas emulsificantes também são adequados, que são normalmente usados em preparações cosméticas. Exemplos não-limitativos dos mesmos incluem gliceril estearato citrato, estearato PEG 40 ou também diestearato de poligliceril(3)-metilglicose, ácido esteárico, steareth-2, steareth-21, isoestearato de glicerila isoceteth-20 ou também cetareth-20.

A fase óleo (lipídeo) das preparações que são preferidas de a-

cordo com a presente invenção é vantajosamente selecionada de ésteres de ácidos alcanocarboxílicos saturados e/ou insaturados, ramificados e/ou não-ramificados tendo um comprimento de cadeia de cerca de 3 a cerca de 30 átomos de carbono e álcoois saturados e/ou insaturados, ramificados e/ou não-ramificados tendo um comprimento de cadeia de cerca de 3 a cerca de 30 átomos de carbono, de ésteres de ácidos carboxílicos aromáticos e álcoois saturados e/ou insaturados, ramificados e/ou não-ramificados tendo um comprimento de cadeia de cerca de 3 a cerca de 30 átomos de carbono. Tais óleos de éster podem depois vantajosamente ser selecionados, por exemplo, de miristato de isopropila, palmitato de isopropila, estearato de isopropila, oleato de isopropil, estearato de n-butila, laurato de n-hexila, oleato de n-decila, estearato de iso-octila, estearato de isononila, isononanoato de isononila, palmitato de 2-etil-hexila, laurato de 2-etil-hexila, estearato de 2-hexildecila, palmitato de 2-octildodecila, oleato de oleíla, erucato de oleíla, erucil oleato, erucil erucato, e misturas sintéticas, semissintéticas e naturais de tais ésteres, por exemplo, óleo de jojoba.

Além disso, a fase óleo pode ser vantajosamente selecionada de hidrocarbonetos ramificados e não-ramificados e ceras de hidrocarboneto, óleos de silicone, éteres de dialquila, o grupo de álcoois saturados ou insaturados, ramificados ou não-ramificados, e triglicerídeos de ácido graxo, a saber, os ésteres de triglicerol de ácidos alcanocarboxílicos saturados e/ou insaturados, ramificados e/ou não-ramificados tendo um comprimento de cadeia de cerca de 8 a cerca de 24, em particular de cerca de 12 a cerca de 18 átomos de carbono. Os triglicerídeos de ácido graxo podem, por exemplo, ser vantajosamente selecionados de óleos sintéticos, semissintéticos e naturais, por exemplo, óleo de oliva, óleo de girassol, óleo de soja, óleo de amendoim, óleo de colza, óleo de amêndoa, azeite de dendê, óleo de coco, óleo da semente de palma, e outros mais.

Quaisquer misturas de tais componentes de óleo e cera também podem ser usadas vantajosamente para os propósitos da presente invenção.

A fase óleo também pode vantajosamente conter óleos de silicone cíclicos ou lineares ou podem consistir totalmente de tais óleos, embora

seja preferível utilizar um conteúdo adicional de outras porções de fase óleo além do óleo de silicone ou óleos de silicone. Ciclometicona (octametilciclotetrassiloxano) ou dimeticona é vantajosamente usada como o óleo de silicone para uso de acordo com a presente invenção. No entanto, outros óleos de silicone também podem ser vantajosamente usados para os propósitos da presente invenção, por exemplo hexametilciclotrissiloxano, polidimetilsiloxano ou poli(metilfenilsiloxano).

Vantajosamente, a concentração da fase óleo é de cerca de 1 % a cerca de 50 % em peso, com base no peso total das preparações, preferivelmente de cerca de 2,5 % a cerca de 30 % em peso, em particular preferivelmente de cerca de 5 % a cerca de 15 % em peso.

Os agentes de formação de gel, também chamados espessantes, são macromoléculas que possuem uma estrutura basicamente linear e possuem forças intermoleculares de interação que permitem ligações de valência secundárias e primárias entre as moléculas individuais e desta maneira a formação de uma estrutura semelhante a rede. Algumas delas são polímeros naturais ou sintéticos solúveis em água que formam géis ou soluções viscosas em sistemas aquosos. Eles aumentam a viscosidade da água mediante a ligação de moléculas de água (hidratação), ou então mediante a absorção e encapsulamento da água em suas macromoléculas entrelaçadas, ao mesmo tempo restringindo a mobilidade da água. Tais polímeros solúveis em água representam um grande grupo de polímeros naturais e sintéticos quimicamente muito diferentes cujo aspecto comum é sua solubilidade em água ou meio aquoso. Um pré-requisito para isto é que estes polímeros tenham vários grupos hidrófilos suficientes para a solubilidade em água e não são tão fortemente reticulados. Os grupos hidrófilos podem ser não-iônicos, aniônicos ou catiônicos por natureza.

Os espessantes vantajosos para preparações cosméticas são, por exemplo, copolímeros de acrilatos de alquila C_{10-30} e um ou mais monômeros de ácido acrílico, ácido metacrílico ou seus ésteres. A designação INCI para tais compostos é "polímero cruzado de acrilatos/acrilato de alquila C_{10-30} ". Particularmente vantajosos são os graus de Pemulen® TR1, TR2 e

TRZ por Goodrich (Noveon).

Os Carbopois também são agentes de formação de gel vantajosos para preparações de acordo com a invenção. Os Carbopois são polímeros de ácido acrílico, em particular também copolímero de acrilato-acrilato de alquila. Os polímeros vantajosos são, por exemplo, os graus 980, 981, 984, 1342, 1382, 2984 e 5984, da mesma maneira os graus de ETD 2001, 2020, 2050 e Carbopol Ultrez 10, copolímero cruzado de decadieno PVM/MA (nome comercial Stabileze 06), metacrilato de poliglicerila, e poliacrilamida. Também os agentes de formação de gel vantajosos para tais preparações são goma xantana, polivinilpirrolidona, derivados de celulose, em particular éteres de celulose, tais como, por exemplo, hidroxipropilmetilcelulose, amido e derivados de amido, ácido hialurônico, farinha de semente de alfarroba, sílica e silicatos de alumínio.

O espessante geralmente está contido em um gel, uma dispersão, uma emulsão e outros mais em uma concentração de cerca de 0,01 % a cerca de 5 % em peso, preferivelmente de cerca de 0,1 % a cerca de 2 % em peso, com base no peso total da composição.

Os polímeros de AMPS podem ser comercialmente disponíveis como substâncias 100 % ativas ou como espessantes inversos.

Exemplos:

- Copolímeros de AMPS reticulados, forma em pó:

Aristoflex AVC (acriloldimetiltaurato de amônio/copolímero VP, Clariant) Aristoflex HMB (acriloldimetiltaurato de amônio/copolímero de metacrilato beheneth-25, Clariant)

- Copolímeros de AMPS reticulados, espessantes inversos:

Simulgel (Seppic): acrilato de hidroxietila/copolímero acriloldimetil taurato de sódio/esqualano/polissorbato

Os polímeros vantajosos para uso na presente invenção são descritos, por exemplo, na DE 100 29 462 A1, a descrição inteira da qual é aqui incorporada por referência.

Acriloldimetiltaurato de amônio/copolímero VP é um polímero de ácido acrilamidometilpropil sulfônico preferido para uso na presente inven-

ção.

Pode ser preferível de acordo com a presente invenção adicionar agentes de complexação nas preparações descritas. Os agentes de complexação são auxiliares conhecidos *per se* na cosmetologia e medicina galênica. Os agentes de complexação, em particular agentes de quelação, formam complexos com átomos de metal; na presença de um ou mais agentes de complexação polibásicos, isto é, agentes de quelação, estes complexos representam metalacidos. Os agentes de quelação são compostos em que um ligante individual ocupa mais do que um sítio de coordenação em um átomo central. Neste caso, portanto, os compostos que são normalmente lineares são fechados como um resultado das formações complexas através de um átomo ou íon de metal para formar anéis. O número de ligantes ligados depende do número de coordenação do metal central. Um pré-requisito para a formação de quelato é que o composto o qual reage com o metal contém dois ou mais grupos atômicos que atuam como doadores de elétron.

O(s) agente(s) de complexação pode(m) vantajosamente ser selecionados de compostos costumeiros, preferência sendo dada a pelo menos uma substância selecionada de ácido tartárico e seus ânions, ácido cítrico e seus ânions, ácidos aminopolycarboxílicos e seus ânions (tais como, por exemplo, ácido etilenodiaminatetra-acético (EDTA) e seus ânions e ácido nitrilotriacético (NTA) e seus ânions.

O(s) agente(s) de complexação está/estão vantajosamente presente(s) nas preparações cosméticas ou dermatológicas em quantidades de cerca de 0,01 % a cerca de 10 % em peso, preferivelmente de cerca de 0,05 % a cerca de 10 % em peso, particularmente preferível de cerca de 0,1 % a cerca de 1,0 % em peso, com base no peso total das preparações.

Os conservantes vantajosos para os propósitos da presente invenção são, por exemplo, álcool benzílico, ácido sórbico e sais destes, doadores de formaldeído (tais como, por exemplo, diazolidinil ureia (nome comercial Germall II da ISP), imidazolidinil ureia (nome comercial Germall 115) ou DMDM hidantoína, que é disponível, por exemplo, sob o nome comercial Glydant® da Lonza), metil isotiazolinona e derivados correspondentes (nome

comercial Kathon CG), butilcarbamatos de iodopropinila (por exemplo, aqueles disponíveis sob os nomes comerciais Glycacil-L, Glycacil-S da Lonza e/ou Dekaben LMB da Jan Dekker), parabenos (isto é, p-hidroxibenzoatos de alquila, tais como metila, etila, propila, isopropila e/ou butil parabeno),
5 fenoxietanol, etanol, triclosan, ácido benzóico e outros mais. Além disso, de acordo com a presente invenção, o sistema de conservante geralmente também de modo vantajoso compreende substâncias que melhoram a eficácia de conservantes clássicos, tais como, por exemplo, hexanodiol, pentanodiol, butileno glicol e metilpropanodiol.

10 É da mesma maneira vantajoso, adicionar antioxidantes nas preparações da presente invenção. De acordo com a invenção, todos os antioxidantes que são adequados e/ou costumeiros para aplicações cosméticas e/ou dermatológicas podem ser usados como antioxidantes favoráveis.

A concentração dos antioxidantes (um ou mais compostos) nas
15 preparações é preferivelmente de cerca de 0,001 % a cerca de 30 % em peso, particularmente preferível de cerca de 0,05 % a cerca de 20 % em peso, em particular de cerca de 1 % a cerca de 10 % em peso, com base no peso total da preparação.

De acordo com a invenção também é possível e vantajoso, utilizar
20 substâncias protetoras de UV que absorvem a radiação UV na faixa de UVB. A concentração total de tais substâncias de filtro pode preferivelmente ser de cerca de 0,1 % em peso a cerca de 30 % em peso, com base no peso total da composição. Os filtros de UVB solúveis em água ou solúveis em óleo comercialmente disponíveis são preferidos. Também pode ser vantajoso
25 utilizar nas preparações de acordo com a presente invenção filtros de UVA que estão geralmente contidos nas preparações cosméticas e/ou dermatológicas. As mesmas quantidades podem ser usadas como aquelas listadas para filtros de UVB.

As preparações cosméticas e/ou dermatológicas de acordo com
30 a invenção também podem conter pigmentos inorgânicos que são costumeiramente usados em cosméticos para a proteção da pele contra os raios UV. Estes são geralmente óxidos de titânio, zinco, ferro, zircônio, silício, manga-

nês, alumínio e misturas dos mesmos. Preferência particular é dada aos pigmentos com base em dióxido de titânio, TiO_2 , ou óxido de zinco, ZnO . As quantidades fornecidas para as combinações acima podem ser usadas.

Os propulsores adequados para formulações cosméticas e/ou dermatológicas de acordo com a invenção que podem ser pulverizados a partir de recipientes de aerossol incluem os propulsores liquefeitos costumeiros conhecidos facilmente voláteis, por exemplo, hidrocarbonetos (propano, butano, isobutano), que podem ser empregados individualmente ou como misturas. O ar comprimido também pode vantajosamente ser usado.

Naturalmente, uma pessoa versada na técnica está ciente de que existem gases propulsores que são não tóxicos *per se* e em princípio seria adequado para realizar a presente invenção na forma de preparações de aerossol, mas que não obstante devem ser evitados por causa de seu impacto inaceitável no meio ambiente ou outras circunstâncias acompanhantes, em particular fluorocarbonos e clorofluorocarbono (CFCs).

As composições cosméticas ou dermatológicas da presente invenção também podem conter minerais de argila tais como silicatos laminares e/ou sílicas quando eles são frequentemente usados como auxiliares de suspensão em desodorantes e antiperspirantes cosméticos contendo óleo.

Os silicatos laminados vantajosos, opcionalmente na forma modificada, para os propósitos da presente invenção, incluem montmorilonita, caolinita, illita, beidelita, nontronita, saponita, hectorita, bentonita e esmectita. Exemplos específicos não-limitativos de silicatos laminados adequados incluem:

montmorilonita	$\text{Na}_{0,33} ((\text{Al}_{1,67}\text{Mg}_{0,33})(\text{OH})_2(\text{Si}_4\text{O}_{10}))$
ou simplificado	$\text{Al}_2\text{O}_3 \cdot 4\text{SiO}_2 \cdot \text{H}_2\text{O} \cdot n\text{H}_2\text{O}$
caolinita	$\text{Al}_2(\text{OH})_4(\text{Si}_2\text{O}_5)$
illita	$(\text{K}, \text{H}_3\text{O})_y (\text{Mg}_3(\text{OH})_2(\text{Si}_{4-y}\text{Al}_y\text{O}_{10}))$ e $(\text{K}, \text{H}_3\text{O})_y (\text{Al}_2(\text{OH})_2(\text{Si}_{4-y}\text{Al}_y\text{O}_{10}))$ $y = 0,7 - 0,9$
beidelita	$(\text{Ca}, \text{Na})_{0,3} (\text{Al}_2(\text{OH})_2(\text{Al}_{0,5}\text{Si}_{3,5}\text{O}_{10}))$
nontronita	$\text{Na}_{0,33} (\text{Fe}_2(\text{OH})_2(\text{Al}_{0,33}\text{Si}_{3,67}\text{O}_{10}))$

saponita	$(\text{Ca}, \text{Na})_{0,33}((\text{Mg}, \text{Fe})_3(\text{OH})_2(\text{Al}_{0,33}\text{Si}_{3,67}\text{O}_{10}))$
hectorita	$\text{Na}_{0,33}((\text{Mg}, \text{Li})_3(\text{OH}, \text{F})_2(\text{Si}_4\text{O}_{10}))$

A montmorilonita constitui o principal mineral das bentonitas de ocorrência natural.

Os silicatos laminados são bem documentados na literatura, vide, por exemplo, os livros didáticos "Lehrbuch der Anorganischen Chemie", A. F. Hollemann, E. Wiberg und N. Wiberg, 91.-100. ed., Walter de Gruyter-Verlag 1985, passim, e "Lehrbuch der Anorganischen Chemie", H. Remy, 12. ed., Akademische Verlagsgesellschaft, Leipzig 1965, passim. A estrutura de lâmina da montmorilonita é documentada em, por exemplo, Römpps Chemie-Lexikon, Franckh'sche Verlagshandlung W. Keller & Co., Stuttgart, 8. ed., 1985, pp. 2668f. As descrições inteiras destes livros são aqui incorporadas por referência.

As preparações de acordo com a presente invenção também podem conter um ou mais tensoativos. Os tensoativos são substâncias anfifílicas que podem dissolver as substâncias não-polares orgânicas em água. Como um resultado de sua estrutura molecular específica tendo pelo menos um componente molecular hidrófilo e um componente molecular hidrofóbico, eles são capazes de reduzir a tensão superficial da água, umedecer a pele, facilitar a remoção e dissolução das manchas, facilitar o enxágue e, se desejável, controlar a espuma.

As porções hidrófilas de uma molécula tensoativa são na maior parte grupos funcionais polares, por exemplo $-\text{COO}^-$, $-\text{OSO}_3^{2-}$, $-\text{SO}_3^-$, enquanto as porções hidrofóbicas são geralmente radicais de hidrocarboneto não-polares. Os tensoativos são geralmente classificados de acordo com o tipo e carga do componente molecular hidrófilo. Sob esse aspecto, é possível diferenciar entre quatro grupos:

- tensoativos aniônicos,
- tensoativos catiônicos,
- tensoativos anfotéricos e
- tensoativos não-iônicos.

O que segue são exemplos vantajosos e não-limitativos das composições da presente invenção.

Exemplo 1 : Daltons que contém álcool– transparentes

	I	II	III
matéria prima (INCI)	% em peso		
álcool desnaturado	20,000	30,000	20,000
hidroxietilcelulose	0,400	0,300	0,400
polietileno glicol 400	3,000	2,000	3,000
polietileno glicol (2000) óleo de rícino hidrogenado	2,000	3,000	2,000
óleo de abacate	0,500	0,100	0,500
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenil-acetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	0,30	0,50
brometo de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenil-acetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	0,50		
perfume, antioxidantes	q.s.	q.s.	q.s.
água	Ad 100,000	Ad 100,000	Ad 100,000

Exemplo 2: Macroemulsões de Creme Desodorante

	I	II	III	IV
matéria prima (INCI)	% em peso			
éter de polietileno glicol(21)estearílico	2,000	1,500	1,000	2,500
éter de polietileno glicol(2)estearílico	2,500	2,500	2,200	1,500
éter de polietileno glicol(15)estearílico	3,000	4,000	4,000	3,000
éster 2-etil-hexílico de ácido graxo de coco	-	-	-	1,000
Na ₃ HEDTA (20 % solução aquosa)	1,500	1,500	1,500	1,500
óleo de abacate	0,100	0,100	0,100	0,100
perfume, antioxidantes	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	0,05	0,3	0,1	0,5
Água	Ad 100,000	Ad 100,000	Ad 100,000	Ad 100,000

	V	VI	VII	VIII
matéria prima (INCI)	% em peso			
éter de polietileno glicol(21)estearílico	2,000	1,000	3,000	1,500
éter de polietileno glicol(2)estearílico	2,000	3,000	2,500	3,000
éter de polietileno	3,000	3,000	3,000	3,000

glicol(15)estearílico				
éter de polietileno glicol(15)estearílico	-	-	1,000	-
Na ₃ HEDTA (20 % solução aquosa)	1,500	1,500	1,500	1,500
óleo de abacate	0,100	0,100	0,100	0,100
perfume, antioxidantes	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	0,01	-	0,2	-
brometo de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenil-acetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio		0,5		0,5
brometo de 4-[(2-butil)-2-hidroxifenil-acetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio				
Água	Ad 100,000	Ad 100,000	Ad 100,000	Ad 100,000

Exemplo 3: Emulsão de O/A

	I	II
matéria prima (INCI)	% em peso	
poligliceril-3-metil glicose diestearato	2,00	2,00
álcool estearílico	2,00	2,00
benzoato de alquila C ₁₂	3,00	3,00

dicaprilato/dicaprato de butileno glicol	2,00	2,00
ciclometicona	3,00	3,00
polideceno hidrogenado	2,00	2,00
dimetilpolissiloxano (dimeticona)	1,00	1,00
petrolato	1,00	1,00
TiO ₂	1,00	1,00
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	2,00	-
brometo de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	1,00
alantoína	0,10	0,10
fenoxietanol	0,40	0,40
carbamato de iodopropinilbutila	0,05	0,05
éster p-hidroxibenzóico alquílico (parabeno)	0,20	0,20
goma xantana	0,10	0,10
Carbomero	0,10	0,10
butileno glicol	3,00	3,00
aditivos (talco, BHT)	0,50	0,50
perfume	q.s.	q.s.
água	Ad 100	Ad 100

Exemplo 4

	I	II
matéria prima (INCI)	% em peso	
diestearato de poligliceril-	3,00	3,00

3-metil glicose		
álcool cetílico	1,00	1,00
Ciclometicona	3,00	3,00
éter dicaprílico	2,00	2,00
parafina líquida	3,00	3,00
trissódio de ácido etileno-diaminatetra-acético	0,10	0,10
Carbômero	0,10	0,10
Hidroxipropilmetilcelulose	0,3	0,3
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	0,50	-
brometo de 4-[(2-(2-butil)-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	0,05
cloridrato de alumínio	5,00	5,00
Glicerina	3,00	3,00
NaOH	q.s.	q.s.
Conservantes	q.s.	q.s.
Perfume	q.s.	q.s.
Água	Ad 100	Ad 100

Exemplo 5

	I	II
matéria prima (INCI)	% em peso	
diestearato de poligliceril-3-metil glicose	3,00	3,00
estearato sorbitano	1,00	1,00
benzoato de alquila C ₁₂	2,00	2,00
éster de ácido graxo de coco etil-hexila	5,00	5,00

octametiltetrassiloxano (ciclometicona)	5,00	5,00
Polideceno	1,00	1,00
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	1,00	-
brometo de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	1,00
Tocoferol	0,10	0,10
EDTA	0,20	0,20
éster para-hidroxibenzóico alquílico (parabeno)	0,40	0,40
Metilpropanodiol	3,00	3,00
etanol, desnaturado	2,00	2,00
goma xantana	0,2	0,2
Carbômero	0,1	0,1
Glicerina	5,00	5,00
carga/aditivos (fosfato de diamido, talco)	2,00	2,00
Perfume	q.s.	q.s.
Água	Ad 100	Ad 100

Exemplo 6: Emulsão de O/A

	I	II
matéria prima (INCI)	% em peso	
estearato citrato de glicerila	1,50	1,50
álcool cetil estearílico	1,00	1,00
triglicerídeo caprílico	1,00	1,00

co/cáprico		
dicaprilcarbonato	2,00	2,00
dimetilpolissiloxano	4,00	4,00
Carbopol	0,15	0,15
ácido acrílico/alquilmetacrilato-copolímero	0,25	0,25
Dimeticona	0,75	0,75
óleo de jojoba	1,00	1,00
acetato de tocoferila	0,75	0,75
Glicerina	10,00	10,00
Etanol	1,00	1,00
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	1,50	-
brometo de 4-[(2-(2-butil)-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	0,75
Perfume	q.s.	q.s.
Conservantes	q.s.	q.s.
Água	Ad 100	Ad 100

Valor do pH ajustado para 6,0.

Exemplo 7: Emulsão de O/A

	I	II
matéria prima (INCI)	% em peso	
estearato citrato de glicerila	3,00	3,00
álcool estearílico	1,00	1,00
triglicerídeo caprílico/cáprico	1,00	1,00

octildodecanol	1,00	1,00
dicapriléter	1,00	1,00
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	0,50	-
brometo de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	0,50
cloridrato de alumínio	3,00	3,00
carbômero	0,15	0,15
glicerina	3,00	3,00
perfume, conservantes, colorantes, antioxidantes, etc.	q.s.	q.s.
Água	Ad 100	Ad 100

Valor do pH ajustado para 5,5.

Exemplo 8: Emulsão de O/A

	I	II
matéria prima (INCI)	% em peso	
estearato citrato de glicerila	3,00	3,00
álcool cetil estearílico	1,00	1,00
ciclometicona	4,00	4,00
octildodecanol	1,00	1,00
dimeticona	1,00	1,00
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	1,00	-
brometo de 4-[(2-ciclo-	-	1,00

hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio		
alantoína	0,10	0,10
ácido cítrico, sal de sódio	0,10	0,10
etanol, desnaturado	3,00	3,00
cloridrato de alumínio zircônio	3,00	3,00
amoniomacrilóil dimetil-taurato/copolímero VP	0,30	0,30
glicerina	10,00	10,00
aditivos (fosfato de di-amido, SiO ₂ , talco)	0,1	0,1
perfume, conservantes, antioxidantes, etc.	q.s.	q.s.
Água	Ad 100	Ad 100

Valor do pH ajustado para 5,5.

Exemplo 9: Emulsão de O/A

	I	II	III
matéria prima (INCI)	% em peso		
estearato citrato de glicerila	2,00	2,00	2,00
álcool cetílico	1,00	1,00	1,00
ciclometicona	3,00	3,00	3,00
óleo de jojoba	0,30	0,30	0,30
parafina líquida	1,00	1,00	1,00
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	1,00	-	-

brometo de 4-[(2-(2-butil)-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	0,75	-
brometo de 4-[(2-(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi)-1,1-dimetil-piperidínio	-	-	0,75
Quitosana	0,50	0,50	0,50
Glicerina	3,00	3,00	3,00
Serina	0,10	0,10	0,10
acetato de tocoferol	1,00	1,00	1,00
goma xantana	0,10	0,10	0,10
perfume, conservantes, colorantes, anti-oxidantes, etc.	q.s.	q.s.	q.s.
Água	Ad 100	Ad 100	Ad 100

Valor do pH ajustado para 6,0.

Exemplo 10: Microemulsão Transparente – role-on

	I	II
matéria prima (INCI)	% em peso	
Monoisostearato de glicerol	1,00	1,00
Monosostearato de glicerol éter polioxietileno(20)isoestearílico	3,00	3,00
Di-n-octilcarbonato	3,00	3,00
2-octildodecanol	2,00	2,00
Glicerina	3,00	3,00
óleo de jojoba	0,10	0,10

brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	1,00	-
brometo de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	1,00
éter de 2-etilexil glicerina	0,50	0,50
quitosana	0,50	0,50
perfume, antioxidantes	q.s.	q.s.
Água	Ad 100	Ad 100

Exemplo 11: Atomizador de Microemulsão Translucente

	I	II
matéria prima (INCI)	% em peso	
éter polioxietileno(20) cetilestearílico	2,00	2,00
éter polioxietileno(12) cetilestearílico	1,00	1,00
estearato de glicerina	2,50	2,50
álcool cetilestearílico	0,50	0,50
palmitato de cetila	0,50	0,50
ácido caprílico/cáprico	4,00	4,00
Di-n-octiléter	8,00	8,00
Glicerina	3,00	3,00
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	0,30	-
brometo de 4-[(2-ciclohexil-2-	-	0,30

hidroxifenilacetil)óxi]- 1,1-dimetil-piperidínio		
pentanodiol	2,50	2,50
perfume, antioxidantes	q.s.	q.s.
Água	Ad 100	Ad 100

Exemplo 12: Macroemulsão – role-on

	I	II	III
matéria prima (INCI)	% em peso		
éter polietilenoglicol(21)estearílico	3,00	3,00	3,00
éter polietilenoglicol(2)estearílico	2,00	2,00	2,00
éter polipropilenoglicol(15)estearílico	2,00	2,00	2,00
EDTA	0,10	0,10	0,10
óleo de abacate	0,10	0,10	0,10
Perfume, antioxidantes	q.s.	q.s.	q.s.
2-etilexil glicerina (octoxiglicerina)	0,50	0,50	0,50
hexanodiol	3,00	3,00	3,00
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]- 1,1-dimetil-piperidínio	0,50	-	-
brometo de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]- 1,1-dimetil-piperidínio	-	0,50	-
brometo de 4-[(2-(2-	-	-	0,50

butil)-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio			
cloridrato de alumínio	3,00	3,00	3,00
Água	Ad 100	Ad 100	Ad 100

Exemplo 13: Macroemulsão – Creme

	I	II	III	IV
matéria prima (INCI)	% em peso			
monoestearato de glicerina	5,00	5,00	5,00	5,00
monoestearato de polietilenoglicol(2000)	2,00	2,00	2,00	2,00
álcool estearílico	300	3,00	3,00	3,00
ciclometicona	4,00	4,00	4,00	4,00
óleo de parafina	6,00	6,00	6,00	6,00
Edta	0,20	0,20	0,20	0,20
quitosana	0,50	0,50	0,50	0,50
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	0,80	0,75	-	-
brometo de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	-	0,80	-
brometo de 4-[(2-(2-butil)-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	-	-	0,80
2-metilpropanodiol	3,00	3,00	3,00	3,00

éter de 2-etilexil glicerina	0,50	0,50	0,50	0,50
antimicótico (clotrimazol ou terbenafina)	-	0,005	-	-
perfume, antioxidantes	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Água	Ad 100	Ad 100	Ad 100	Ad 100

Exemplo 14: Solução alcoólica – role-on

	I	II
matéria prima (INCI)	% em peso	
álcool, desnat.	25,00	25,00
hidroxietilcelulose	0,50	0,50
polietilenoglicol 400	5,00	5,00
óleo de rícino hidrogendo de polietilenoglicol (2000)	4,00	4,00
óleo de macadâmia	0,20	0,20
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	0,30	-
brometo de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	0,30
pentanodiol	5,00	5,00
éter 2-etil-hexílico	0,50	0,50
perfume, antioxidantes	q.s.	q.s.
Água	Ad 100	Ad 100

Exemplo 15: Spray de Aerossol Tipo A

	I	II	III
matéria prima (INCI)	% em peso		

2-octildodecanol	0,50	0,50	0,50
1,2-propilenoglicol	1,00	1,00	1,00
ácido butiloctanóico	0,25	0,25	0,25
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	0,50	0,50	-
brometo de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio			0,50
antimicótico (clotrimazol ou terbenafina)		0,005	
Perfume	q.s.	q.s.	q.s.
Etanol	Ad 100	Ad 100	Ad 100

A fase líquida obtida pela mistura entre si dos respectivos constituintes é despejada no recipiente de aerossol com uma mistura de propano-butano (2,7) em uma relação de 39:61.

Exemplo 16: Spray de Aerossol Tipo B

	I	II	III
matéria prima (INCI)	% em peso		
cloridrato de alumínio	45,00	25,00	25,00
palmitato de isopropila	25,00	30,00	30,00
Ciclometicona	AD 100,00	0,30	0,30
isoparafina	-	AD 100,00	AD 100,00
talco	-	10,00	10,00
ácido 2-	0,25	0,30	0,25

hexildecanóico			
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	0,50	0,20	-
brometo de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	0,25	-	-20
PERFUME	q.s.	q.s.	q.s.

A fase líquida obtida pela mistura entre si dos respectivos constituintes é despejada no recipiente de aerossol com uma mistura de propano-butano (2,7) em uma relação de 17:83.

Exemplo 17: Emulsão de O/A

	I	II	III
matéria prima (INCI)	% em peso		
citrato de gliceril-tearato	2,00	2,00	2,00
álcool cetilestearílico	2,00	2,00	2,00
ciclometicona	3,00	3,00	3,00
triglicerídeos de ácido caprílico/ácido cáprico	4,00	4,00	4,00
octildodecanol	1,00	1,00	1,00
dimeticona	2,00	2,00	2,00
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	0,50	-	-

brometo de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	0,50	-
brometo de 4-[(2-(2-butil)-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	-	0,50
ácido cítrico, sal de sódio	0,10	0,10	0,10
etanol, desnaturado	3,00	3,00	3,00
amonioacrilóil dimetiltaurato/copolímero VP	0,30	0,30	0,30
glicerina	3,00	3,00	3,00
cargas (fosfato de diamido, talco)	0,10	0,10	0,10
perfume, cargas	q.s.	q.s.	q.s.
Água	Ad 100	Ad 100	Ad 100

Exemplo 18: Emulsão de O/A

	I	II
matéria prima (INCI)	% em peso	
estearato de PEG-40	2,00	2,00
estearato de glicerila	2,00	2,00
álcool estearílico	0,50	0,50
álcool cetílico	2,00	2,00
benzoato de alquila C ₁₂	2,00	2,00
15 triglicerídeos de ácido caprílico/ácido cáprico	1,00	1,00

ciclometicona	3,00	3,00
carbonato de dicaprilila	2,00	2,00
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	0,75	-
brometo de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	0,75
ácido tartárico, sal de sódio – fenoxietanol	0,10	0,10
Fenoxietanol	0,40	0,40
diazolidiniluréia	0,20	0,20
etanol, desnaturado	8,00	8,00
amonioacrilóil dimetil-taurato/copolímero VP	0,80	0,80
Glicerina	5,00	5,00
cargas (fosfato de diamido, BHT, talco)	0,10	0,10
perfume, colorantes	q.s.	q.s.
Água	Ad 100	Ad 100

Exemplo 19: Microemulsão

	I	II
matéria prima (INCI)	% em peso	
lecitina	1,00	1,00
oleth-15	5,00	5,00
fenoxietanol	0,50	0,50
hexamidiniluréia	0,10	0,10
carbamato de iodopropinilbutila	0,25	0,25
acrilatos/polímero cru-	0,30	0,30

zado de acrilato de alquila C ₁₀₋₃₀		
Poliuretano-4 (Avalure UR-445)	0,50	0,50
copolímero AMPS transformado em hidrofóbico	0,20	0,20
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	1,00	-
brometo de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	1,00
cloridrato de alumínio		
Glicerina	6,00	6,00
Perfumes	q.s.	q.s.
cargas (fosfato de diamido, SiO ₂ , talco, estearato de alumínio)	q.s.	q.s.
Água	Ad 100	Ad 100

Exemplo 20: Microemulsão

	I	II
matéria prima (INCI)	% em peso	
lecitina	1,00	1,00
oleth-15	5,00	5,00
fenoxietanol	0,50	0,50
hexamidiniluréia	0,10	0,10
carbamato de iodopropinilbutila	0,25	0,25
acrilatos/polímero cru-	0,30	0,30

zado de acrilato de alquila C ₁₀₋₃₀		
Poliuretano-4 (Avalure UR-445)	0,50	0,50
copolímero AMPS transformado em hidrofóbico	0,20	0,20
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	1,00	-
brometo de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	1,00
glicerina	6,00	6,00
perfume	q.s.	q.s.
cargas (fosfato de diâmido, SiO ₂ , talco, estearato de alumínio)	q.s.	q.s.
Água	Ad 100	Ad 100

Exemplo 21: Microemulsão Transparente – role-on

	I	II
matéria prima (INCI)	% em peso	
monoisoestearato de glicerina	1,00	1,00
éter polioxietileno(20)isoestearílico	2,00	2,00
Di-n-octilcarbonato	3,00	3,00
2-octildodecanol	1,00	1,00
pantenol	1,00	1,00
óleo de jojoba	0,10	0,10

hidroxietilcelulose hidrofobicamente modificada	0,20	0,20
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	0,50	-
brometo de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	0,50
2-fenoxietanol	0,50	0,50
perfume, antioxidantes	q.s.	q.s.
Água	Ad 100	Ad 100

Exemplo 22: Microemulsão translúcida – atomizador

	I	II
matéria prima (INCI)	% em peso	
éter polioxietileno(20) cetilestearílico	2,00	2,00
éter polioxietileno(12) cetilestearílico	1,00	1,00
estearato de glicerina	2,00	2,00
álcool cetilestearílico	0,50	0,50
palmitato de cetila	0,50	0,50
éster de ácido caprílico/cáprico	3,00	3,00
Di-n-octiléter	7,00	7,00
glicerina	3,00	3,00
carragenina	0,2	0,2
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-	0,50-	

piperidínio		
brometo de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	0,50
2-fenoxietanol	0,50	0,50
perfume, antioxidantes	q.s.	q.s.
Água	Ad 100	Ad 100

Exemplo 23: Macroemulsão – role-on

	I	II	III
matéria prima (INCI)	% em peso		
éter polietilenoglicol(21)estearílico	3,00	3,00	3,00
éter polietilenoglicol(2)estearílico	2,00	2,00	2,00
éter polipropilenoglicol(15)estearílico	2,00	2,00	2,00
EDTA	0,1	0,1	0,1
taurato de acriloldimetila	0,4	0,4	0,4
óleo de macadâmia	0,10	0,10	0,10
perfume, antioxidantes	q.s.	q.s.	q.s.
2-fenoxietanol	0,5	0,5	0,5
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	1,50	-	-
brometo de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-	-	1,00	-

1,1-dimetil-piperidínio			
brometo de 4-[(2-(2-butil)-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	-	1,00
Água	Ad 100	Ad 100	Ad 100

Exemplo 24: Atomizador de bomba

	I	II
matéria prima (INCI)	% em peso	
etanol	55,00	55,00
óleo de rícino hidrogenado PEG-40	2,00	2,00
glicerina	1,00	1,00
ácido 2-butiloctanóico	0,20	0,20
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	0,50-	
brometo de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	0,50
perfume	q.s.	q.s.
Água	Ad 100,00	Ad 100,00

Exemplo 25: Gel Role-on

	I	II	III
matéria prima (INCI)	% em peso		
etanol	50,00	50,00	50,00
óleo de rícino hidrogenado PEG-40	2,00	2,00	2,00

hidroxietilcelulose	0,50	0,50	0,50
ácido 2-butiloctanóico	0,20	0,30	0,30
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	0,10	0,20	-
brometo de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	-	0,20
cloridrato de alumínio	-	10,00	10,00
perfume	q.s.	q.s.	q.s.
Água	Ad 100,00	Ad 100,00	Ad 100,00

Exemplo 26: Emulsão role-on

		II	III
matéria prima (INCI)	% em peso		
cloridrato de alumínio	-	10,00	10,00
éter polipropilenoglicol(15)estearílico	5,00	5,00	5,00
éter polietilenoglicol(100)estearílico	1,00	1,00	1,00
éter polietilenoglicol(2)estearílico	4,00	4,00	4,00
ácido 2-hexildecanoico	0,20	0,30	0,30
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-	1,00	3,00	-

hidroxifenilacetil)óxi]- 1,1-dimetil-piperidínio			
brometo de 4-[(2- ciclo-hexil-2- hidroxifenilacetil)óxi]- 1,1-dimetil-piperidínio	-	-	3,00
Perfume, conservan- tes	q.s.	q.s.	q.s.
Água	Ad 100,00	Ad 100,00	Ad 100,00

Exemplo 27: Bastão Desodorante Tipo A

	I	II	III
matéria prima (INCI)	% em peso		
estearato de sódio	7,00	7,00	7,00
1,2-propilenoglicol	48,00	48,00	48,00
brometo de 4-[(2- ciclopentil-2- hidroxifenilacetil)óxi]- 1,1-dimetil- piperidínio	0,20	0,30	-
brometo de 4-[(2- ciclo-hexil-2- hidroxifenilacetil)óxi]- 1,1-dimetil- piperidínio	-	-	0,30
ácido 2- butiloctanóico	-	0,10	0,10
ácido 2- hexildecanoico	0,20	-	-
perfume, conservan- tes	q.s.	q.s.	q.s.
Água	Ad 100	Ad 100	Ad 100

Exemplo 28: Bastão Desodorante Tipo B

	I	II	III
matéria prima (INCI)	% em peso		
estearato de sódio	8,00	8,00	8,00
1,2-propilenoglicol	45,00	45,00	45,00
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	0,20	0,30	-
brometo de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	-	0,30
ácido 2-butiloctanóico	-	0,50	0,50
ácido 2-hexildecanoico	0,50	-	-
éter polietilenoglicol(25)cetearílico	3,00	3,00	3,00
etanol	20,00	20,00	20,00
perfume, conservantes	q.s.	q.s.	q.s.
Água	Ad 100	Ad 100	Ad 100

Exemplo 29: Spray de Aerossol

matéria prima (INCI)	% em peso		
	I	II	III
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	0,6	0,5	-
brometo de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	-	0,50

lactato de quitosana	0,50	0,30	-
ciclometicona	8,50	-	12,80
benzoato de alquila C ₁₂₋₁₅	3,00	5,00	-
carbonato de dica- prilila	-	2,00	-
iso-hexadecano	-	9,10	-
polidimetilsiloxano	0,90	1,00	2,00
diesteardimônio hec- torito	0,60	-	0,40
dióxido de silício	-	1,10	0,30
talco	-	-	3,00
perfume	0,90	1,00	1,00
mistura de gás pro- pulsor	85,00	80,00	80,00
Total	100,00	100,00	100,00

Exemplo 30: Bastão

matéria prima (INCI)	% em peso		
	I	II	III
brometo de 4-[(2- ciclopentil-2- hidroxifenilacetil)óxi]- 1,1-dimetil- piperidínio	0,5	1,0	-
brometo de 4-[(2- ciclo-hexil-2- hidroxifenilacetil)óxi]- 1,1-dimetil- piperidínio	-	-	0,5
cloridrato de quito- sana	0,5	0,5	-
ciclometicona	51,0	45,0	45,2

benzoato de alquila C ₁₂₋₁₅	-	15,0	10,0
éter butílico PPG-14	-15,0	5,0	-
polidimetilsiloxano	-	-	10,0
diesteardimônio hec- torito	1,0	-	1,0
dióxido de silício	-	1,0	0,8
álcool estearílico	20,0	20,0	18,0
óleo de rícino hidro- genado	1,0	1,5	1,5
talco	10,0	10,0	12,0
perfume	1,0	1,0	1,0
Total	100,0	100,0	100,0

Exemplo 31: Rolo Desodorante

matéria prima (INCI)	% em peso		
	I	II	III
brometo de 4-[(2- ciclopentil-2- hidroxifenilacetil)óxi]- 1,1-dimetil- piperidínio	0,5	1,0	-
brometo de 4-[(2- ciclo-hexil-2- hidroxifenilacetil)óxi]- 1,1-dimetil- piperidínio	-	-	1,0
acetato de quitosana	0,3	0,4	0,4
ciclometicona	82,2	76,0	76,0
benzoato de alquila C ₁₂₋₁₅	2,0	5,0	5,0
poli-isobuteno	0,5	2,0	2,0
iso-hexadecano	10,0	5,0	5,0

bentonita Quaterni-um-90	2,5	2,8	2,8
óleo mineral		5,0	5,0
carbonato de propileno	0,5	0,8	0,8
Água	0,5	1,0	1,0
perfume	1,0	1,0	1,0
Total	100,0	100,0	100,0

Exemplo 32 – Microemulsão Transparente – role-on

matéria prima (INCI)	% em peso		
	I	II	III
monoisoestearato de glicerina	2,00	2,00	2,00
éter polioxietileno(20)isoestearílico	4,00	4,00	4,00
Di-n-octil carbonato	2,00	2,00	2,00
2-octildodecanol	2,00	2,00	2,00
glicerina	3,00	3,00	3,00
óleo de abacate	0,10	0,10	0,10
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	0,05	-	-
brometo de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	0,05	-
brometo de 4-[(2-(2-butil)-2-hidroxifenilacetil)óxi]-	-	-	0,05

1,1-dimetil-piperidínio			
quitosana	0,50	0,50	0,50
ácido láctico	0,13	0,13	0,13
perfume, antioxidantes	q.s.	q.s.	q.s.
Água	Ad 100	Ad 100	Ad 100

Exemplo 33: Microemulsão Translúcida – atomizador

	I	II
matéria prima (INCI)	% em peso	
éter polioxietileno(20) cetilestearílico	3,00	3,00
éter polioxietileno(12) cetilestearílico	0,50	0,50
estearato de glicerina	3,00	3,00
álcool cetil estearílico	0,50	0,50
palmitato de cetila	0,50	0,50
éster de ácido caprílico/cáprico	5,00	5,00
Di-n-octiléter	5,00	5,00
glicerina	4,00	4,00
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	0,15	-
brometo de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	0,15
lactato de quitosana	0,30	0,30
perfume, antioxidantes	q.s.	q.s.
Água	Ad 100	Ad 100

Exemplo 34: Macroemulsão – role-on

	I	II
matéria prima (INCI)	% em peso	
éter polietilenoglicol(21)estearílico	2,00	2,00
éter polietilenoglicol(2)estearílico	2,50	2,50
éter polipropilenoglicol(15)estearílico	3,00	3,00
sal de trissódio de ácido etilenodiaminatetraacético (20 % solução aquosa)	1,50	1,50
óleo de abacate	0,10	0,10
perfume, antioxidantes	q.s.	q.s.
ácido láctico	0,1	0,1
Quitosana	0,5	0,5
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	0,25	-
brometo de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	0,25
Água	Ad 100	Ad 100

Exemplo 35: Solução alcoólica – role-on

	I	II
matéria prima (INCI)	% em peso	
álcool desnat.	20,00	20,00
hidroxietilcelulose	0,40	0,40
polietilenoglicol 400	3,00	3,00

óleo de rícino hidro- gendo de polietilenoglicol (2000)	2,00	2,00
óleo de abacate	0,50	0,50
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	0,05	-
brometo de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	0,05
cloridrato de quitosana	0,2	0,2
perfume, antioxidantes	q.s.	q.s.
Água	Ad 100	AD 100

Exemplo 36: Creme Gel de O/A

	I	II
matéria prima (INCI)	% em peso	
estearato citrato de glicerila	1,25	1,25
álcool cetilestearílico	0,75	0,75
triglicerídeo caprílico/cáprico	1,00	1,00
carbonato de dicaprila	2,00	2,00
dimetilpolissiloxano, cíclico (dimeticona)	4,00	4,00
CARBOPOL	0,15	0,15
ácido acrílico/ copolímero de alquilmetacrilato C10-30	0,25	0,25
dimeticona	0,75	0,75
óleo de jojoba	1,00	1,00

miristato de miristila	1,00	1,00
acetato de tocoferila	0,75	0,75
glicerina	10,00	10,00
etanol	1,00	1,00
lactato de quitosana	0,80	0,80
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	1,50	-
brometo de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	1,50
perfume	Q.S.	Q.S.
Conservantes	Q.S.	Q.S.
Água	Ad 100	Ad 100

Valor do pH ajustado para 5,0

Exemplo 37: Emulsão de O/A

	I	II
matéria prima (INCI)	% em peso	
estearato citrato de glicerila	3,00	3,00
álcool estearílico	1,00	1,00
triglicerídeo caprílico/cáprico	1,00	1,00
octildodecanol	1,00	1,00
éter dicaprílico	1,00	1,00
ácido láctico	0,08	0,08
quitosana	0,30	0,30
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-	0,50	-

1,1-dimetil-piperidínio		
brometo de 4-[(2-ciclo- hexil-2- hidroxifenilacetil)óxi]- 1,1-dimetil-piperidínio	-	0,50
carbômero	0,15	0,15
glicerina	3,00	3,00
perfume, conservantes, colorantes, antioxidan- tes	q.s.	q.s.
Água	Ad 100	Ad 100

Valor do pH ajustado para 5,5.

Exemplo 38 Emulsão de O/A

	I	II
matéria prima (INCI)	% em peso	
diestearato de poliglice- ril-3-metil glicose	3,00	3,00
álcool estearílico	3,00	3,00
benzoato de alquila C ₁₂₋₁₅	3,00	3,00
dicaprilato/dicaprato de butileno glicol	2,00	2,00
triglicerídeo de ácido caprílico/ácido cáprico	3,00	3,00
polideceno hidrogenado	2,00	2,00
dimetilpolissiloxano (dimeticona)	1,00	1,00
ácido láctico	0,25	0,25
quitosana	1,00	1,00
brometo de 4-[(2- ciclopentil-2- hidroxifenilacetil)óxi]-	2,00	-

1,1-dimetil-piperidínio		
brometo de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	2,00
fosfato de sódio ascorbila	0,10	0,10
fenoxietanol	0,40	0,40
carbamato de iodopropinilbutila	0,05	0,05
éster p-hidroxibenzóico alquílico (parabeno)	0,20	0,20
goma xantana	0,10	0,10
carbômero	0,10	0,10
butileno glicol	2,00	2,00
aditivos (talco, BHT)	0,50	0,50
perfume	q.s.	q.s.
Água	Ad 100	Ad 100

Exemplo 39: Emulsão de O/A

	I	II
matéria prima (INCI)	% em peso	
estearato de PEG-40	2,00	2,00
estearato de glicerila	2,00	2,00
álcool estearílico	0,50	0,50
álcool cetílico	2,00	2,00
benzoato de alquila C ₁₂ - 15	2,00	2,00
triglicerídeo de ácido caprílico/cáprico	1,00	1,00
ciclometicona	3,00	3,00
carbonato de cicaprilila	2,00	2,00
ácido láctico	0,25	0,25

Quitosana	1,00	1,00
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	0,75	-
brometo de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	0,75
ácido tartárico, sal de sódio	0,10	0,10
fenoxietanol	0,40	0,40
diazolidiniluréia	0,20	0,20
etanol desnaturado	8,00	8,00
acriloldimetiltaurato de amônio/copolímero de VP	0,80	0,80
glicerina	5,00	5,00
cargas (fosfato de diâmido, SiO ₂ , talco, estearato de alumínio)	0,10	0,10
perfume, colorantes	q.s.	q.s.
Água	Ad 100	Ad 100

Exemplo 40: Microemulsão

	I	II
matéria prima (INCI)	% em peso	
Ecitina	1,00	1,00
oleth-15	5,00	5,00
fenoxietanol	0,50	0,50
hexamidiniluréia	0,10	0,10
carbamato de iodopropinilbutila	0,25	0,25

goma xantana	0,10	0,10
Poliuretano-4 (Avalure UR-445)	0,50	0,50
copolímero AMPS transformado em hidrofóbico	0,20	0,20
quitosana	0,30	0,30
ácido láctico	0,08	0,08
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	1,00	-
brometo de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	1,00
glicerina	6,00	6,00
perfume	q.s.	q.s.
cargas (fosfato de diâmido, SiO ₂ , talco, estearato de alumínio)	q.s.	q.s.
Água	Ad 100	Ad 100

Exemplo 41: Spray de aerossol

matéria prima (INCI)	% em peso		
	I	II	III
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	0,5	0,5
brometo de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-	0,50		

dimetil-piperidínio			
ciclometicona	9,0	-	12,8
benzoato de alquila C ₁₂₋₁₅	3,0	5,0	-
carbonato de dicaprila	-	2,0	-
iso-hexadecano	-	9,4	-
polidimetilsiloxano	0,9	1,0	2,0
diesteardimônio hectorito	0,6	-	0,4
dióxido de silício	-	1,1	0,3
talco	-	-	3,0
perfume	0,9	1,0	1,0
mistura de gás propulsor	85,0	80,0	80,0
Total	100,0	100,0	100,0

Exemplo 42: Bastões

matéria prima (INCI)	% em peso		
	I	II	III
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	0,5	1,0	0,5
brometo de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	0,5	1,0	-
ciclometicona	51,5	45,5	45,5
benzoato de alquila C ₁₂₋₁₅	-	15,0	10,0
éter butílico PPG-14	15,0	5,0	-
polidimetilsiloxano	-	-	10,0
diesteardimônio hectorito	1,0	-	1,0
dióxido de silício	-	1,0	0,5
álcool estearílico	20,0	20,0	18,0
óleo de rícino hidrogenado	1,0	1,5	1,5
talco	10,0	10,0	10,0

Perfume	1,0	1,0	1,0
Total	100,0	100,0	100,0

Exemplo 43: Rolos desodorantes

matéria prima (INCI)	% em peso		
	I	II	III
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	0,5	1,0	-
brometo de 4-[(2-ciclohexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	-	-	1,0
ciclometicona	82,5	76,4	76,4
benzoato de alquila C ₁₂₋₁₅	2,0	5,0	5,0
poli-isobuteno	0,5	2,0	2,0
iso-hexadecano	10,0	5,0	5,0
bentonita Quternium-90	2,5	2,8	2,8
óleo mineral	-	5,0	5,0
carbonato de propileno	0,5	0,8	0,8
Água	0,5	1,0	1,0
Perfume	1,0	1,0	1,0
Total	100,0	100,0	100,0

Exemplo 44: Géis de limpeza da pele

matéria prima (INCI)	% em peso				
	I	II	III	IV	V
laureth sulfato de sódio	13,2	11	9,5	11	9,5
brometo de cocamidopropila	1,65	3,3	3,8	3,3	3,8
gliceril cocoato de PEG-7		---	---	---	2,0

Laureth-2	---	---	---	0,1	---
gliceril isoestearato de PEG-90	---	---	---	0,3	---
cocoil glutamato de sódio	1,25	0,75	2,5	0,75	0,75
óleo de rícino hidrogenado de PEG-40	0,50	0,50	0,50	0,50	0,50
gliceril palmitato hidrogenado de PEG-100	0,50	0,50	0,50	0,50	0,50
brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio	0,025	0,025	0,05	0,02	0,1
Poliquaternium-10	0,2	---	0,20	---	---
benzoato de sódio	0,45	0,45	0,45	0,45	0,45
salicilato de sódio	0,20	0,20	0,20	0,20	0,20
ácido cítrico	0,50	0,50	0,50	0,50	0,50
perfume	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Água	Ad 100	Ad 100	Ad 100	Ad 100	Ad 100

Exemplo 45

Para testar a atividade antiperspirante dos compostos da presente invenção, brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio [Gpip] foi comparado com o glicopirrolato, (1,1-dimetil-2,3,4,5-tetra-hidropirrol-3-il) 2-ciclopentil-2-hidróxi-2-fenil-acetato [GP], e clo-
 5 roidrato de alumínio [ACH]. A água serviu como um padrão. Especificamente, cada um dos compostos de teste acima foi aplicado nos antebraços das pessoas de teste em três dias subsequentes durante quatro horas cada. No dia 3, cerca de 6 horas após a aplicação, as pessoas de teste foram para
 10 uma sauna e impressões de silicone foram feitas. Cada gotícula de suor cria uma impressão na composição de silicone e o número de impressões é ana-

lisado por meio de um analisador de imagem. As áreas tratadas foram automaticamente padronizadas com respeito a uma área não tratada. Os resultados são expressos em termos da atividade da glândula sudorípara residual % e são graficamente representados na Figura 1. A Figura 2 mostra os resultados de um estudo *in vitro* por meio de um ensaio de ativação do receptor. O estímulo das células sem incubação precedente com um composto de piperidínio serve como um controle.

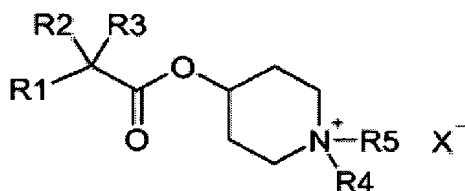
Os resultados representados nas figuras 1 e 2 mostram que o composto de piperidínio de acordo com a presente invenção apresenta uma atividade antiperspirante elevada que é significativamente mais elevada do que aquela de um antiperspirante padrão tal como cloridrato de alumínio e ainda visivelmente mais elevada do que aquela do glicopirrolato que difere do composto de a presente invenção essencialmente na presença de um anel de pirrolidínio (5 membros) em lugar de um anel de piperidínio (6 membros) em sua estrutura molecular.

O presente pedido reivindica a prioridade do Pedido de Patente norte-americana N°. 11/449.720, depositado em 09 de junho de 2006, cuja descrição inteira é aqui expressamente incorporada por referência.

É observado que os exemplos precedentes foram fornecidos meramente para o propósito de explicação e de maneira alguma devem ser interpretados como limitativos da presente invenção. Embora a presente invenção tenha sido descrita com referência às formas de realização exemplares, fica entendido que as palavras que foram usadas são palavras de descrição e ilustração, em vez de palavras de limitação. Mudanças podem ser feitas, dentro do campo de ação das reivindicações anexas, como atualmente mencionadas e como emendadas, sem divergir do escopo e espírito da presente invenção e seus aspectos. Embora a presente invenção tenha sido aqui descrita com referência aos meios, materiais e formas de realização particulares, a presente invenção não é destinada a ser limitada aos particulares aqui descritos; de preferência, a presente invenção se estende a todas as estruturas, métodos e usos funcionalmente equivalentes, tais como são dentro do escopo das reivindicações anexas.

REIVINDICAÇÕES

1. Composição cosmética ou dermatológica que compreende pelo menos um sal de piperidínio de fórmula (I):



(I)

em que:

- 5 R_4 e R_5 independentemente representam H ou alquila $C_1 - C_6$;
 R_1 e R_3 independentemente representam cicloalquila $C_3 - C_8$ opcionalmente substituída, fenila opcionalmente substituída ou alquila $C_1 - C_6$ opcionalmente substituída;
 R_2 representa H, OH e OR em que R representa alquila $C_1 - C_7$; e
 10 X^- representa um ânion cosmética ou dermatologicamente aceitável;
 e um veículo cosmética ou dermatologicamente aceitável.

2. Composição de acordo com a reivindicação 1, em que na fórmula (I)

- R_4 e R_5 independentemente representam alquila $C_1 - C_4$;
 15 R_1 representa cicloalquila $C_3 - C_8$ opcionalmente substituída ou fenila opcionalmente substituída;
 R_3 representa cicloalquila $C_3 - C_8$ opcionalmente substituída, fenila opcionalmente substituída, isopropila, 2-butila, 2-pentila, 3-pentila, 2-hexila e 3-hexila; e
 20 R_2 representa H, OH ou OR, em que R representa alquila $C_1 - C_3$.

3. Composição de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 e 2, em que na fórmula (I)

- R_4 e R_5 independentemente representam alquila $C_1 - C_3$;
 R_1 representa fenila opcionalmente substituída; e
 25 R_3 representa isopropila, 2-butila, 2-pentila, 3-pentila, 2-hexila, 3-hexila ou cicloalquila $C_3 - C_8$ opcionalmente substituída.

4. Composição de acordo com qualquer uma das reivindicações

de 1 a 3, em que na fórmula (I)

R_4 e R_5 são idênticos e representam metila ou etila;

R_1 representa fenila não-substituída;

R_3 representa 2-butila ou cicloalquila $C_4 - C_6$ opcionalmente substituída; e

R_4 representa H ou OH.

5. Composição de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 4, em que na fórmula (I)

R_4 e R_5 representam metila; e

10 R_3 representa 2-butila, ciclopentila opcionalmente substituída ou ciclo-hexila opcionalmente substituída.

6. Composição de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 5, em que na fórmula (I)

R_3 representa 2-butila, ciclopentila e ciclo-hexila; e

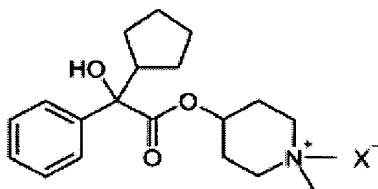
15 R_2 representa H ou OH.

7. Composição de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 6, em que X representa halogêneo, sulfato, carbonato, ascorbato ou fosfato.

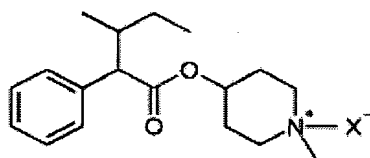
8. Composição de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 7, em que X representa halogêneo.

9. Composição de acordo com a reivindicação 1, em compreendendo pelo menos um de

(a) um sal de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio de fórmula

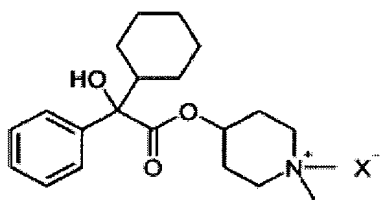


25 (b) um sal de 4-[(2-(2-butil)-fenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio de fórmula



e

(c) um sal de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxfenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio de fórmula



10. Composição de acordo com a reivindicação 9, X representa
5 halogênio, sulfato, carbonato, ascorbato ou fosfato.

11. Composição de acordo com a reivindicação 9, X é Cl, Br ou
I.

12. Composição de acordo com a reivindicação 9, X representa
Br.

10 13. Composição de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 12, em que pelo menos um sal de fórmula (I) está presente em uma concentração de cerca de 0,001 % a cerca de 15 % em peso, com base no peso total da composição.

15 14. Composição de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 13, em que pelo menos um sal de fórmula (I) está presente em uma concentração de cerca de 0,05 % a cerca de 10 % em peso, com base no peso total da composição.

20 15. Composição de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 14, em que pelo menos um sal de fórmula (I) está presente em uma concentração de cerca de 0,1 % a cerca de 5 % em peso, com base no peso total da composição.

16. Composição de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 15, em que a composição está presente em uma forma que é adequada para aplicação tópica.

17. Composição de acordo com a reivindicação 16, em que a composição está presente como um creme, uma loção, um gel, um unguento, uma tintura, um óleo de pele, uma loção leitosa, um bálsamo, uma bandagem impregnada, um tecido impregnado, um têxtil impregnado, um spray impregnado, um spray, um aerossol, um role-on, um bastão, um sólido macio, um pó ou um spray em pó.

18. Composição de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 17, em que a composição está presente em uma forma que é adequada para uso como um antiperspirante.

19. Composição de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 18, em que a composição ainda compreende pelo menos uma substância desodorizante.

20. Composição de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 19, em que a composição é substancialmente livre de substâncias ativas antiperspirantes que são diferentes de um sal de fórmula (I).

21. Composição de acordo com a reivindicação 20, em que a composição é substancialmente livre de compostos de alumínio.

22. Composição de acordo com qualquer uma das reivindicações de 1 a 19, em que a composição ainda compreende pelo menos um composto de alumínio ativo antiperspirante.

23. Composição de acordo com a reivindicação 22, em que o pelo menos um composto de alumínio ativo antiperspirante está presente em uma concentração de cerca de 0,1 a cerca de 30 em peso, com base no peso total da composição.

24. Composição de acordo com a reivindicação 23, em que a composição compreende pelo menos um de cloridrato de alumínio opcionalmente ativado, cloreto de alumínio e um composto de alumínio zircônio.

25. Composição de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 24, em que a composição está presente como um líquido ou sabão em barra, um aerossol, um bastão desodorante, um creme, uma loção, uma tintura desodorizante, um agente de higiene feminina desodorizante, um xampu desodorizante, um banho de chuveiro desodorizante ou preparação

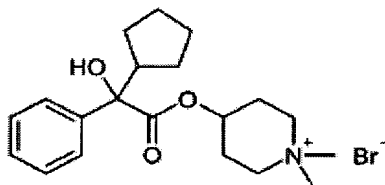
de banho, um pó desodorizante ou um spray em pó desodorizante.

26. Composição de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 25, em que a composição está presente em combinação com um recipiente de aerossol, um frasco de compressão, um dispositivo de bomba ou um dispositivo role-on.

27. Método para a redução ou inibição da perspiração, em que o método compreende a aplicação de uma quantidade eficaz antiperspirante da composição como definida em qualquer uma das reivindicações de 1 a 25 na pele.

28. Método de acordo com a reivindicação 27, em que a composição compreende pelo menos uma de uma microcápsula, uma microemulsão e uma nanoemulsão.

29. Composto, a saber, brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio de fórmula:



30. Composição cosmética ou dermatológica, em que a composição compreende o composto como definida na reivindicação 29, em combinação com um veículo cosmético ou dermatologicamente aceitável.

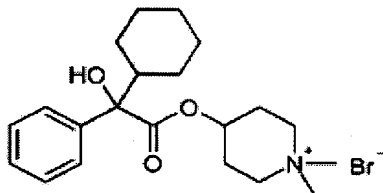
31. Composição de acordo com a reivindicação 30, em que a composição está presente em uma forma que é adequada para aplicação como um antiperspirante.

32. Composição de acordo com qualquer uma das reivindicações 30 e 31, em que a composição ainda compreende pelo menos uma substância desodorizante.

33. Composição de acordo com qualquer uma das reivindicações 30 a 32, em que a composição é substancialmente livre de substâncias ativas antiperspirantes que são diferentes de brometo de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio e brometo de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio.

34. Método para a redução ou inibição da perspiração, em que o método compreende a aplicação de uma quantidade efetiva antiperspirante do composto como definido na reivindicação 29 na pele.

35. Composto, a saber, brometo de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio de fórmula:



36. Composição cosmética ou dermatológica, em que a composição compreende o composto como definido na reivindicação 35, em combinação com um veículo cosmético ou dermatologicamente aceitável.

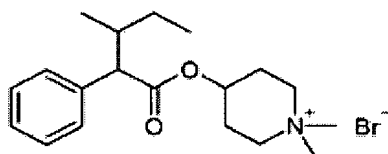
37. Composição de acordo com a reivindicação 36, em que a composição está presente em uma forma que é adequada para aplicação como um antiperspirante.

38. Composição de acordo com qualquer uma das reivindicações 36 e 37, em que a composição ainda compreende pelo menos uma substância desodorizante.

39. Composição de acordo com qualquer uma das reivindicações 36 a 38, em que a composição é substancialmente livre de substâncias ativas antiperspirantes que são diferentes de brometo de 4-[(2-ciclo-pentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio e brometo de 4-[(2-ciclo-hexil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio.

40. Método para a redução ou inibição da perspiração, em que o método compreende a aplicação de uma quantidade eficaz antiperspirante do composto como definido na reivindicação 35 na pele.

41. Composição cosmética ou dermatológica, em que a composição compreende um composto de fórmula



em combinação com um veículo cosmético ou dermatologicamente aceitável.

42. Composição de acordo com a reivindicação 41, em que a composição está presente em uma forma que é adequada para aplicação
5 como um antiperspirante.

43. Composição de acordo com qualquer uma das reivindicações 41 e 42, em que a composição ainda compreende pelo menos uma substância desodorizante.

44. Uso de pelo menos um sal de piperidínio de fórmula (I), como definido na reivindicação 1, para preparar uma composição cosmética ou
10 dermatológica para a redução ou inibição da perspiração.

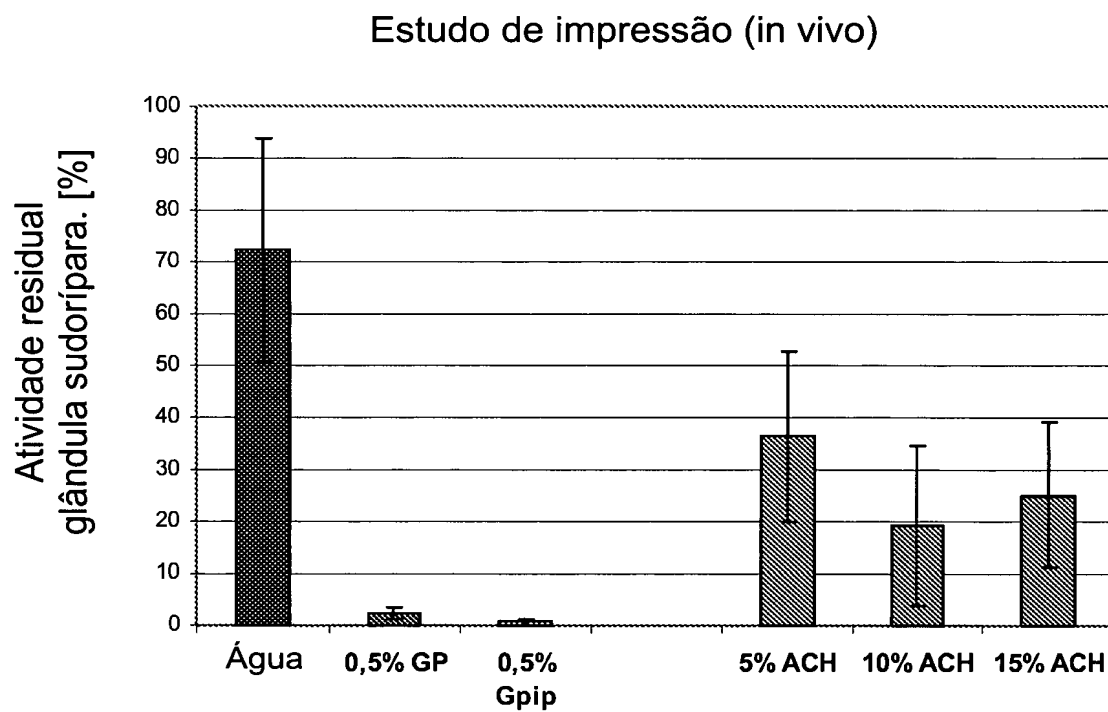
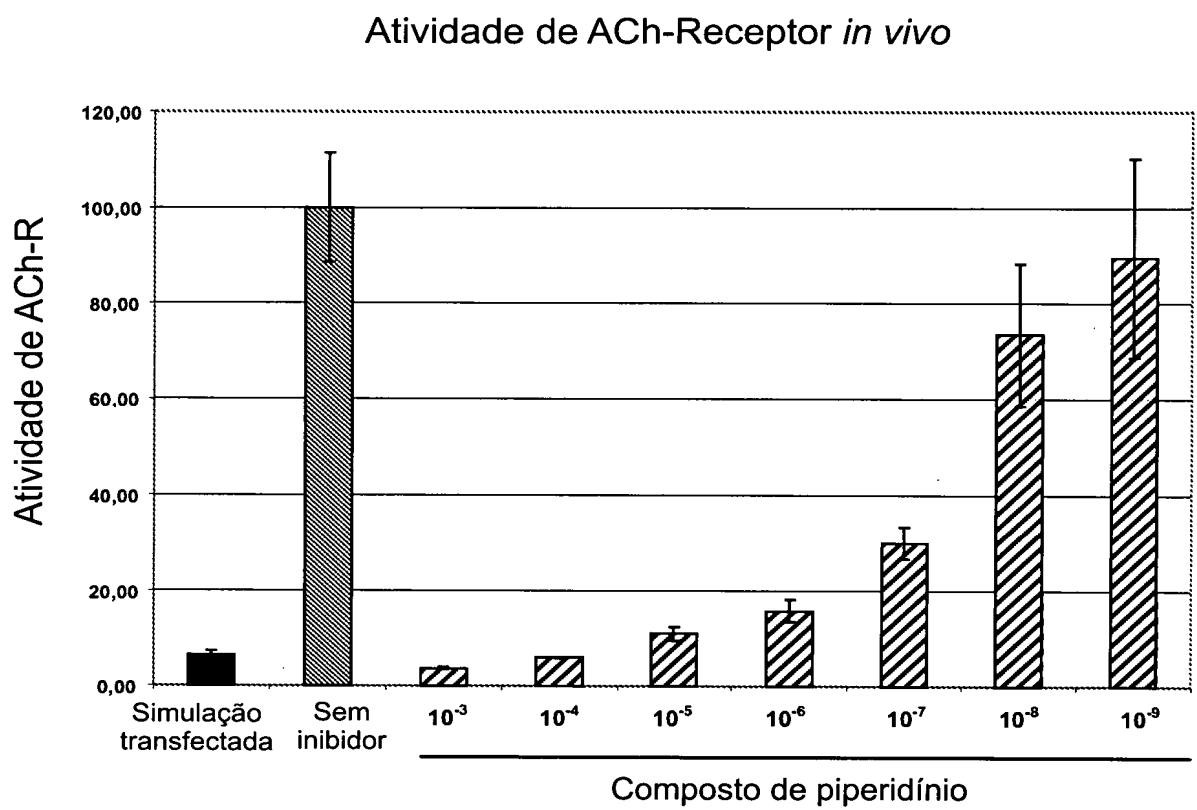
FIG. 1

FIG. 2



RESUMO

Patente de Invenção: "COMPOSTOS DE PIPERIDÍNIO E COMPOSIÇÕES COSMÉTICAS CONTENDO-OS".

5 A presente invenção refere-se a composições cosméticas ou dermatológicas que compreendem pelo menos um sal de piperidínio, preferivelmente um sal de 4-[(2-ciclopentil-2-hidroxifenilacetil)óxi]-1,1-dimetil-piperidínio, e o seu uso, particularmente como antiperspirantes.